

## 第十九章 益智药和大脑功能改善药

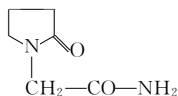
大脑的活动和脑内物质代谢，血液循环以及神经递质等有密切关系。在第十八章内已叙述了一些影响乙酰胆碱的药物和与老年痴呆的关系，本章内着重叙述一些对脑物质代谢有关的药物。

益智药 (nootropics) 为 Ginrges 于 1972 年首次定义的一类中枢神经系统药物，能选择性地作用于大脑皮质，对活动不正常的大脑细胞进行激活、保护并使之恢复正常反应。临床上可用于治疗由于物理或化学因素引起的脑功能损伤、脑缺氧和慢性脑功能不全。对于老年人由于衰退而引起的脑功能障碍（如痴呆）也有一定裨益。

本类药物常与血管舒张-循环促进药、抗血小板药等联合应用。

### 吡拉西坦

#### Piracetam



【其他名称】脑复康

【作用】保护、修复并激活大脑细胞，增高传递信息的电位波，提高大脑 ATP/ADP 比值和葡萄糖利用率以及能量贮备。

【体内过程】口服易吸收，成人口服 1.5g，3~4 小时药物在脑脊液中浓度达峰值，体内不代谢，服药后 1 日内大部分药物经肾排泄。

【应用】对由于衰老引起的反应迟钝、嗜睡、头晕、记忆和精神活动衰退等症状有改进作用。也用于头部外伤或手术后、脑炎或一氧化碳中毒后以及乙醇中毒等意识状态的恢复。

口服：成人 每次 0.4~0.8g(必要可增至 1.6g)，1 日 3 次。儿童酌减。一般 2~4 周为 1 疗程。

静脉注射：4~6g，每日 2 次，7~14 天为一个疗程。

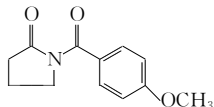
【不良反应】① 消化道反应有恶心、腹部不适、纳差、腹痛等，为剂量相关型不良反应。② 中枢反应有神经质、兴奋、头晕、头痛和睡眠障碍。舞蹈病患者服本品可加重症状。③ 肝功能损害（如转氨

酶升高）偶见。

片剂 0.4g  
注射剂 2.0g

### 茴拉西坦

#### Aniracetam



【其他名称】三乐喜，阿尼西坦

【性状】白色或类白色结晶性粉末、无臭、味苦，在水中几乎不溶。

【作用】保护神经细胞，激活脑细胞代谢，并有增强记忆和促智作用。

【应用】对脑梗死、脑出血及脑血管病后的记忆减退、中老年记忆衰退、痴呆有缓解作用。

口服：每次 0.2g，每日 3 次；70 岁以上老人，每次 0.1g，一日 3 次。一般疗程为 1~2 月，根据用药效应，剂量和疗程可调整。

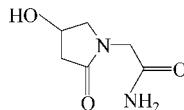
【不良反应】偶有口干、嗜睡、头昏、便秘、食欲减退等。

【注意】妊娠、哺乳期妇女、严重肝肾功能不全者慎用。

片剂、胶囊剂 0.1g

### 奥拉西坦

#### Oxiracetam



【作用】本品可促进磷酰胆碱和磷酰乙醇胺合成，促进脑代谢。

**【体内过程】**本品口服吸收迅速，进入血液后迅速分布到全身，达峰时间约为1小时，峰浓度为48.3~54.9 $\mu\text{g}/\text{ml}$ ，清除半衰期为5~8小时。服药后48小时内约40%的原形药从尿中排出。本品在不同年龄的正常健康人体内的消除规律基本一致。

**【应用】**本品为促智药，临床用于老年痴呆，多梗死痴呆及神经官能症、脑外伤、脑炎等症引起的大脑功能不全、记忆力障碍。

**口服：**每次800mg，每日2~3次。

**静注或肌注：**每次1g。

**【注意】**肾功能不全者，使用本品时应十分谨慎，并需降低剂量。对本品过敏者与肾功能严重不全者禁用。

**【评价】**本品治疗痴呆有效，总有效率为80%，其疗效与吡拉西坦相似，且无明显不良反应。本品对神经系统、心血管系统、呼吸系统以及对肝肾、血液系统均无明显不良影响。

胶囊剂 400mg/粒  
注射剂 1g/5ml; 1g(粉针)

### 甲氯芬酯

Meclofenoxate



本品制品为甲氯芬酯的盐酸盐。

**【其他名称】**氯酯醒，遗尿丁

**【性状】**为白色结晶性粉末，略有异臭，味苦，极易溶于水。

**【作用】**甲氯芬酯能促进脑细胞的氧化还原过程，增加机体对碳水化合物的利用，调节神经细胞的代谢。对于抑制状态的中枢神经系统有兴奋作用。

**【应用】**本品临床用于新生儿缺氧症、颅脑外伤性昏迷、老年精神混乱、儿童精神迟钝、小儿遗尿和乙醇中毒等。其作用产生缓慢，要反复应用，效果才较显著。

●成人 **口服：**0.1~0.2g/次，1日3次，至少服用1周。

**肌注：**昏迷状态时0.25g/次，每2小时1次。

**静注或滴注：**临用前以注射用水或5%葡萄糖注射液溶解成5%~10%溶液供静注，溶于5%葡萄糖注射液250~500ml供静滴，100~300mg/次，1日3次。

●小儿 **口服：**0.1g/次，1日3次。

**肌注：**新生儿缺氧症时，60mg/次，每2小时

1次。

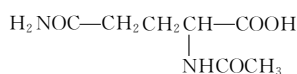
**脐静脉注射：**60~100mg/次，1日2次，药物配制方法同成人。

**【不良反应】**内服偶见胃部不适，失眠。注射时偶有血管痛、血压波动和失眠等。

片剂 0.1g  
注射剂 0.1g; 0.25g

### 醋谷胺

Aceglutamide



**【其他名称】**乙酰谷酰胺，Acetylglutamide

**【作用】**醋谷胺为谷氨酸的乙酰化物，有改善神经细胞代谢，维持神经应激能力及降低血氨的作用，并能通过血脑屏障。其铝盐-醋谷胺铝(Aceglutamide Aluminium)可用于胃溃疡治疗。

**【应用】**本品用于脑外伤昏迷、肝昏迷、偏瘫、高位截瘫、小儿麻痹后遗症、神经性头痛、腰痛等。

●成人 **肌内注射或静脉滴注：**1日100~600mg。

**静滴：**5%或10%葡萄糖溶液250ml稀释后缓慢滴注。

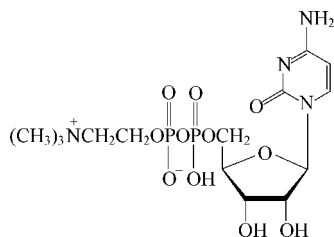
●小儿剂量酌减。对神经性头痛、腰痛，亦可穴位注射。

**【注意】**可能引起血压下降。

注射剂 100mg/2ml

### 胞磷胆碱

Citicoline



**【其他名称】**胞二磷胆碱

**【作用】**本品为核苷衍生物，能促进卵磷脂的

生物合成。可增强脑干网状结构，尤其是与意识密切相关的上行网状结构激动系统的机能；并增强锥体系统的机能，改善运动麻痹；通过减少脑血管阻力，增加大脑血流与氧耗量，促进大脑物质代谢。当患者的大脑和中枢神经系统因各种外伤而产生脑组织代谢障碍和意识障碍时，对促进大脑功能的恢复和苏醒有一定的作用。

**【应用】**本品主要用于急性脑外伤和脑手术以及中风后遗症等引起的意识障碍，有改善其意识状态及脑波的作用。当脑水肿开始减退，意识障碍有望恢复时使用本品能促进恢复过程。本品也可用于其他中枢神经系统急性损伤引起的功能和意识障碍。

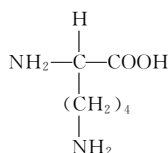
成人 **静滴**：200～600mg/日，可用5%或10%葡萄糖注射液稀释后应用，5～10日为1疗程。**肌注**：200mg/日。剂量可根据病情和年龄适当增减。

**【注意】**①在脑内出血急性期，不宜用大剂量（单剂500mg以上）。对于急性症状严重、并存在继续发展的意识障碍病人，应并用止血药，降颅压药。②如有严重脑水肿，应同时使用降颅压药。③静注速度宜缓慢。④副作用较小，偶可发生恶心、厌食、烧灼感等。有时可有一时性血压下降、不眠、兴奋等。

注射剂 0.2g/2ml；0.25g/2ml

### 赖氨酸

Lysine



**【性状】**白色粉末，无毒，无异味，易溶于水。

**【作用】**赖氨酸系人体必需氨基酸之一，是肽激素和辅酶的前体物质之一，能促进体内丙酮酸的代谢，使其进一步氧化生成乙酰辅酶A，利于神经组织中的乙酰胆碱（ACh）合成，促进神经递质的代谢而兴奋神经中枢。本品能透过血脑屏障，直接进入脑组织，帮助神经组织修复，促进神经细胞再生；还能影响呼吸链，具有抗脑组织缺氧的功能，提高脑组织生理功能，增强记忆力。此外，本品还能抑制纤维蛋白酶原的激活因子，使纤维蛋白酶原不能成为纤维蛋白酶，而达到止血的作用，其功效与氨基己酸（EACA）相同。本品还具有促进人体

生长发育、增强人体免疫能力的作用。

**【应用】**用于颅脑损伤、脑血管病及脑动脉硬化、老年性脑萎缩、痴呆、精神病症、神经功能失调、一氧化碳中毒、记忆力减退；也可用于赖氨酸缺乏引起的营养不良、食欲不振、倦怠和消瘦及作为贫血、急慢性肝炎等的辅助用药。

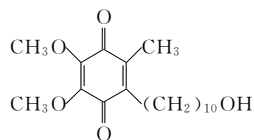
**口服**：3g/次，每日3次，300～500g为1疗程，汤水或开水送服。

**【注意】**急性缺血性脑血管疾患、高氧血症、酸中毒者慎用。肝、肾功能严重不全者禁用。

粉剂 3g

### 艾地苯醌

Idebenone



**【其他名称】**雅伴，羟癸甲氧醌，Avan

**【性状】**橙黄色至橙色结晶、结晶性粉末或块状物，无臭；几乎不溶于水。

**【作用】**本品参与细胞线粒体代谢，对缺血后脑的能量代谢和脑组织功能有保护作用；能改善脑内神经递质的代谢，提高大脑的葡萄糖利用率，促进脑内ATP生成，抑制乳酸生成和脂质过氧化作用，保护血管壁细胞膜的稳定性。

**【体内过程】**口服本品30mg，3小时血药浓度达峰值290μg/ml。 $t_{1/2}$ 为8小时。24小时内尿中排泄为32%，而且大部分为代谢产物。

**【应用】**适用于改善脑梗死后遗症、脑出血后遗症、动脉硬化症等伴随的情绪低落、情感障碍、语言障碍。

**口服**：30mg/次，每日3次，饭后服。可根据年龄及症状适当增减。

**【注意】**对本品过敏者、孕妇、哺乳期妇女慎用。

**【不良反应】**无严重副作用，有时可出现下列症状：①过敏性皮疹，此时应停药；②食欲不振、胃疼、恶心、腹泻；③精神神经反应，如多动、痉挛；④红细胞、白细胞减少；⑤肝脏SGOT，SGPT，ALP增高；⑥肾脏BUN增高；⑦无力、倦怠，总胆固醇和甘油三酯增高。

片剂 30mg

## 脑蛋白水解物

### Brain Protein Hydrolysate

本品是从动物脑组织中提取的一种游离氨基酸和分子量在 1 万以下的低肽类物质的水溶液，每 1ml 本品含 1g 脑蛋白中的含氮物质。

【其他名称】脑活素，Cerebrolysin

【作用】本品在脑神经细胞内可促进蛋白质合成并影响其呼吸链，具有抗缺氧的保护能力，改善脑能量代谢。本品还含有神经递质、肽类激素及辅酶的前体物，可激活腺苷酸环化酶和其他激素系统，使氨基酸代谢恢复正常，改善学习和记忆，增强大脑对各种应激、损伤等恶性刺激的抵抗力（本品资料主要根据制造商介绍）。

【体内过程】本品可透过血脑屏障进入神经细胞。吸收约 50%~80%。氨基酸在脑内迅速代谢， $t_{1/2}$  由数秒到数小时。

【应用】用于脑血管病、脑外伤后遗症、脑软化或中风后遗症、大脑发育不全、痴呆、记忆减退为主神经衰弱等。

① 皮下注射：2ml/次。② 肌注：5ml/次。  
③ 静注：10ml/次。④ 静滴：10~30ml/次。静滴时，将本品 10~30ml 加入 250ml 生理盐水中，1~2 小时缓慢滴完。每日 1 次，连用 8~10 日。

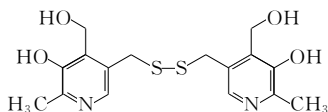
【注意】① 有过敏体质者慎用。② 严重肾功能不全者和孕妇禁用。

【不良反应】可有热感、过敏、寒战等。

注射剂 1ml；5ml；10ml

## 吡硫醇

### Pyritinol



【其他名称】脑复新

【性状】本品为 2 分子吡多辛以双硫键连接的化合物。制品盐酸盐为白色粉末，无臭，味苦酸，易溶于水。

【作用】促进脑葡萄糖和氨基酸代谢，增加颈动脉和脑血流量，增强钠离子通透性，并促使葡萄糖透过血脑屏障。

【应用】脑外伤、脑炎和脑膜炎后遗症，包括头痛、头晕、失眠、记忆力减退、注意力不集中、情绪变化等，本品起改善症状作用。尚可用于

脑动脉硬化症。

口服：成人每次 100~200mg，小儿每次 50~100mg，每日 3 次。

静滴：200~400mg，每日 1 次，用 0.9% 氯化钠或 5% 葡萄糖注射液 250ml 稀释后滴入。

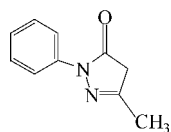
【注意】少数病人可出现皮疹、恶心想吐，并可引起睡眠障碍加重。孕妇慎用。

片剂 100mg

注射剂 200mg/2ml

## 依达拉奉

### Edaravone



【作用】清除自由基，抑制脂质过氧化，保护脑、血管内皮和神经细胞避免氧化损伤。

【应用】治疗脑梗死，改善急性脑梗死所致的症状和功能障碍，提高生活能力。

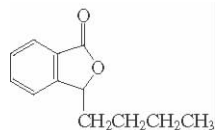
尽可能在发病 24 小时内给药，每次 30mg，加入 0.9% 氯化钠注射液中滴注，30 分钟内滴完，每日 2 次。1 个疗程在 14 日以内。

【注意】不良反应有肝功能异常（ALT、AST 上升）和皮疹。本品可加重急性肾功能不全，重度肾功能衰竭者禁忌。与由肾大量排泄的药物合用，可加重肾损害。与葡萄糖或氨基酸等混合可致本品浓度降低。孕妇、哺乳期妇女禁用。

注射剂 10mg/5ml

## 丁苯酞

### Butylphthalide



【其他名称】恩必普，NBP，消旋-3-正丁基苯酞

【性状】本品为软胶囊，内容物为黄色或深黄色油状液体。遮光，在阴凉处密封保存。

【作用】本品与芹菜籽中提取的左旋芹菜甲素

的结构相同，为其人工合成的消旋体。动物药效学研究提示，本品可阻断缺血性脑卒中所致脑损伤的多个环节，具有较强的抗脑缺血作用，明显缩小大鼠局部脑缺血的梗死面积，减轻脑水肿，改善脑能量代谢和缺血脑区的微循环和血流量，抑制神经细胞凋亡，并具有抗脑血栓形成和抗血小板聚集作用。通过降低花生四烯酸含量，提高脑血管内皮NO和PGI<sub>2</sub>的水平，抑制谷氨酸释放，降低细胞内钙浓度，抑制自由基和提高抗氧化酶活性等机制发挥作用。

**【体内过程】**健康男性口服100mg、200mg、400mg本品后，达峰时间分别为0.88小时、1.25小时、1.25小时；峰浓度分别为(78.7±115.8)mg/ml，(204.7±149.0)ng/ml，(726.6±578.7)ng/ml。食物影响本品的吸收，餐后口服达峰时间推迟，峰浓度降低，药代动力学参数个体间有明显差异。动物实验表明，胃肠道的吸收较快，70%以代谢形式排出，主要代谢产物为侧链羟甲基化代谢产物和内酯开环后的氧化代谢产物，主要从尿中排泄。

**【应用】**本品为脑组织保护药，适用于轻、中度急性缺血性脑卒中。根据现有临床研究的用药方法，本品应与复方丹参注射液联合使用。

**空腹口服：**一次0.2g，一日4次，10~12天为一疗程，或遵医嘱。

**【注意】**①食物影响药物吸收，建议餐前服用；②肝肾功能受损者、有严重出血倾向者慎用；③用药过程中需注意肝功能变化；④因本品尚未进行出血性脑卒中临床研究，故不推荐出血性脑卒中患者使用；⑤有精神症状者慎用；⑥吞咽功能障碍者，不宜服用；⑦对本品或芹菜过敏者禁用。

**【不良反应】**本品不良反应较少，主要为转氨酶轻度升高，根据随访观察的病例，停药后可恢复正常，偶见恶心，腹部不适，皮疹及精神状态等。

胶囊剂 0.1

## 鼠神经生长因子

Mouse Nerve Growth Factor

**【其他名称】**恩经复，NOBEX，金路捷

**【性状】**本品为白色冻干疏松体。溶解后溶液应为无色澄明液体，不应有异物、混浊和沉淀。

**【成分】**主要成分系从小鼠颌下腺中提取纯化的神经生长因子(mNGF)。

**【作用】**本品具有保护营养神经元、促进神经修复再生的作用。

**【应用】**适用于正己烷中毒性周围神经病。尚可试用于①化学品、毒品所致的周围神经损伤、急性脑血管性中枢神经损伤；②各种外周神经损伤，如挫伤、神经断裂及神经再植；③颅脑、脊髓外伤；④急性脑血管病、帕金森病、脑萎缩、早老性痴呆；⑤周围神经疾病；⑥新生儿缺血缺氧性脑病、脑瘫；⑦多发性神经炎、神经退行性变、面神经炎、视神经炎、带状疱疹；⑧放疗、化疗引发的周围神经损伤。

**肌注：**用2ml注射用水溶解，一天1次，每次4~12μg，四周为一疗程，可遵医嘱多疗程连续给药。儿童用药请遵医嘱。

**【注意】**注射部位痛或注射侧下肢疼痛，一般无须处理。对本品过敏者禁用。过敏体质者慎用；孕妇和哺乳期妇女慎用。本品加注射用水震荡后即可完全溶解，如有不溶的沉淀、混浊或絮状物时不可使用。

**【药物过量】**应按说明书规定剂量使用，除特殊需要，每日用量不超过80μg，否则有可能出现神经敏感性增强现象。

**【评价】**注射用神经生长因子(NGF)已经用于临床，近几年国内有多家药厂生产，商品名称不同。请注意批准文号，一定仔细阅读说明书；尽管有许多资料表明可以用来治疗某些疾病，并取得一定效果。但是一定注意是否为首选药物，还是辅助性治疗。比如，治疗帕金森病，本品不是首选药物。

注射剂不同产品规格不同 40μg(2000AU)；  
20μg(4500AU)

## 第二十章 麻醉药和骨骼肌松弛药

### 第一节 全身麻醉药

全身麻醉状态是药物引起的所有感觉的感受消失。为了全身麻醉和外科手术的需要使用全身麻醉药（简称全麻药），以抑制中枢神经系统功能、保证催眠、镇痛、肌肉松弛以及控制内脏反射反应。虽然使用一种药物就可达到要求，但实际上更多的是采用合并用药来实现。全身麻醉药可有种种给药途径，但以静脉或吸入给药较好，因为采用这两种方法能更好地预测有效剂量和作用时间过程。

现代选用的吸入性全麻药将其安全范围和不良反应的发生率，诸如对肺、心和循环的影响，以及对其他器官系统不太明显的作用，视为可接受性的主要条件。

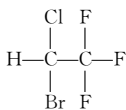
一般说吸入全麻药中以异氟烷为最安全，氟烷起效较快，氧化亚氮的镇痛和基础麻醉虽可信，但作用较弱，现已少用；乙醚麻醉时诱导期和苏醒期均较长，麻醉后恶心或呕吐的发生率高，加上易燃、易爆，现已不用。

静脉全麻药一般仅适用于时间短、镇痛要求不高的小手术，单独使用的范围不广。临床常用于吸入全麻的诱导，以及复合全麻中，使病人安静、倦睡、对外界环境应激反应迟钝，且作用可持续到手术结束或更长。

普遍应用的全麻药，是一些安全范围狭窄，不良反应及危险性较大的药品，应由专职人员使用。

#### 氟烷

Halothane



【其他名称】三氟氯溴乙烷

【性状】本品为无色澄明易流动的液体，有类似氯仿的气味。可与非挥发性油混合，在水中微溶（1：400）。氟烷和空气或氧气的混合气体不会

爆炸。

【作用】氟烷是一种强效全麻药，其强度为乙醚的4倍，氯仿的2倍。血/气分配系数相对较高，因此麻醉的诱导相对较慢，和恢复时间不长；不刺激咽喉，支气管痉挛不常见，故诱导平稳。

应用氟烷的特征是剂量依赖性动脉血压下降，伴有心输出量和搏出量的减少，以及各器官血流分布有较大的改变，心率减慢或短暂心律失常。

氟烷麻醉通过中枢抑制使肌肉有一些松弛，但仍需要并用肌肉松弛药加强；其镇痛作用较差，必须并用阿片类镇痛药；并需用其他适当药物来抑制内脏反射。

氟烷可抑制肝功能，但停用后可以很快恢复。

氟烷能松弛子宫平滑肌，产前期这种松弛作用可以用于胎儿倒转术；分娩时，则抑制自然的人工诱导的子宫收缩，可延长产程，增加失血。

氟烷的安全范围不大，易产生循环抑制，表现为动脉压明显降低。

【体内过程】氟烷在应用后最初24小时内从呼气中排出被吸收的原形约60%~80%，在几天、甚至几周内继续由呼气中排出少量。未被呼出的部分大约15%主要通过肝P450酶进行生物转化，其余则原形从其他途径排出。尿中可见代谢产物三氟醋酸或溴化物。

【应用】本品不燃烧、对黏膜无刺激性，可用于通常各种手术的全麻，尤其是不需显著肌肉松弛的场合。由于血压降低，可减少手术时出血。

吸入全麻的吸气内浓度按蒸气计：

1. 全麻诱导 成人浓度逐渐增大以3%为限，小儿以1%~2%为限；
2. 全麻维持 成人0.5%~1%，小儿0.3%。

【注意】①严重肝、肾功能不全及剖腹产患者禁用。②对有心脏病、氧不足、酸中毒或电解质异常时，可引起过速性心律失常，应禁用。③重复使用时应隔3个月以上。④用琥珀色瓶装，避光阴凉处保存。

【不良反应】偶有恶心、呕吐、畏寒、恶性高热、心律失常、血压下降等。麻醉恢复期出现明显的震颤。

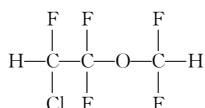
罕见肝细胞坏死。

**【相互作用】** 碱石灰并不促进氟烷的分解。除镍和钛外，银、铜、不锈钢、镁、铝、锡等都能被氟烷腐蚀或生锈。氟烷与橡皮和某些塑料有相互作用，但与聚乙烯不起作用。氟烷增加心肌对儿茶酚胺的敏感性。可诱发心律失常，故禁与儿茶酚胺类药物合用。

溶液剂 20ml；100ml(含 0.01%麝香草酚为稳定剂的液体)

### 恩氟烷

Enflurane



**【其他名称】** 安氟醚，易使宁，Ethrane

**【性状】** 无色、透明液体，有果香，稍有甜味。本品不燃、不爆，化学性质极其稳定且不含防腐剂。

**【作用】** 本品为含氟吸入麻醉剂，1966 年开始用于临床，其物理性质保证了麻醉的诱导和恢复，以及维持期间调节麻醉深度能够平稳和比较快。当吸入约 4% 恩氟烷时，不到 10 分钟即可达到适合于外科手术的麻醉深度。对涎液和支气管、气管分泌有轻度刺激作用，但无需特殊处理。呼吸受到抑制，通常需辅助通气。随麻醉程度的加深，动脉压逐渐降低。心率保持不变，一般无心搏徐缓出现。

本品能明显增强非去极化型肌松药作用。可使子宫肌松弛，分娩、剖腹产或人工流产时可使失血增加。

不影响血液凝固，也不改变血象。

**【体内过程】** 约有 80% 以原形从呼气中排出，其余大约 2%~8% 在肝脏 CYP 2E1 酶氧化代谢，代谢产物为无机氟化物和有机氟化物。15% 经皮肤、汗腺和粪排出。

**【应用】** 本品用于全麻的诱导和维持，可与多种静脉全麻药与全身麻醉辅助药联合使用。

1. 全麻诱导 可单独和氧气一起吸入或与氧化亚氮-氧气混合吸入，浓度由 0.5% 开始，逐步升高。每数次呼吸后增加 0.5%，直到达外科麻醉期为止，吸入浓度一般成人要逐渐增至 3.0%，以 4.5% 为极限。

2. 全麻维持 用 0.5%~2% 可达到手术期的麻醉深度。维持浓度不超过 3%，一般为 1.5%~

2%；小儿酌减。

**【注意】** ① 原有肾功能障碍或肾移植的患者，使用本品会加重肾损害，应慎用。② 深度麻醉时可伴发呼吸和循环抑制，高浓度时可发生癫痫发作，癫痫发作及颅内压高者慎用或禁用。③ 对妊娠妇女的安全性尚未明确。④ 可引起子宫松弛，故分娩时相对禁忌做深度麻醉。

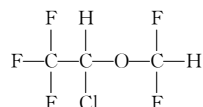
**【不良反应】** 手术后也许有 3%~15% 的病人发生恶心和呕吐，亦有心律失常，手术后发抖现象。但发生率比氟烷或甲氧氟烷少。可在麻醉时或麻醉后出现肝损害，但不明显，且可很快恢复。如疑有过敏时应选用另外的麻醉药。用较高浓度本品时或有低二氧化碳血症时可看到颞、颜面、颈部或肢体的肌肉痉挛或抽搐。先前存在 EEG 异常或有发作性疾病史者应避免使用本品。

**【相互作用】** 能明显增强非去极化型肌松药作用，合用时应减少恩氟烷用量。

溶液剂 250ml

### 异氟烷

Isoflurane



**【其他名称】** 异氟醚，活宁，易而迷

**【性状】** 异氟烷是一种挥发性麻醉药，和恩氟烷属异构体，所以理化特性相似。为无色、透明液体，略具醚样刺激性臭，性稳定。1979 年用于临床。

**【作用】** 异氟烷的血/气分配系数 (1.4) 比氟烷及恩氟烷低，诱导麻醉和麻醉后恢复都比用恩氟烷稍快，但由于有轻度刺激性又限制了气体的吸入浓度，因而诱导比氟烷慢。但改变麻醉深度则容易得多。

用异氟烷时心肌功能维持良好，血压随剂量增加而下降，主要由于周围血管扩张所致。呼吸抑制比用氟烷深得多，但小于恩氟烷，呼吸频率不发生改变。具有骨骼肌松弛作用，如再加用非去极化型肌松药，则异氟烷用量可大大减少。此药对中枢神经的兴奋作用没有恩氟烷那样明显。

**【体内过程】** 99% 以原形由呼吸道排出，在体内 0.2% 被 CYP 2E1 氧化代谢。生物降解仅为恩氟烷的 1/10，氟烷的 1/100，对肝、肾的毒性小。未

见有致畸、致突变、致癌作用。

**【应用】**本品用于全身吸入麻醉。

1. 全麻诱导 吸入浓度由0.5%开始,在7~10分钟内逐渐提高到1.5%~3%。

2. 全麻维持 1%~2.5%配以氧/氧化亚氮混合物,单独用氧时需再加0.5%~1%本品。

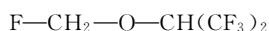
**【注意】**①本品能导致流产,除剖宫产外产科应禁用;②应密切监护血压变化及呼吸状况;③注意颅内压增高,可加强换气以减少脑血流量的增加;④使用本品导致恶性高热史者、对卤族麻醉药过敏者禁用。

**【不良反应】**①可产生低血压和呼吸抑制,在诱导期和恢复期少数人可出现咳嗽、气憋、上呼吸道分泌增多;②使用浓度过大时,偶见喉或支气管痉挛、寒战、恶心、呕吐等;③与其他麻醉药相比较副作用较轻;④异氟烷是强有效的冠状血管扩张剂,伴有冠脉血流增加及心肌耗氧量减少,理论上讲,本品应特别适用于缺血性心脏病,然而一些这类患者,狭窄血管支配区的心肌血液供应依赖于侧支循环,本品引起正常区域血管扩张,可能会造成从侧支循环血管“窃血”,从而加重心肌缺血,但这一担心并未被相继的动物及人类研究证实。

溶液剂 100ml

### 七氟烷

Sevoflurane



**【其他名称】**七氟醚,七氟异丙甲醚

**【性状】**挥发性液体,沸点58.6℃,25℃蒸气压力26.7kPa(200mmHg)。化学性质不够稳定,与钠石灰接触后可引起裂解。

**【作用】**本品为含氟的吸入麻醉药,经呼吸道吸入,产生与剂量相关的中枢神经系统抑制作用,致意识消失,可缓和及消除对各种伤害性刺激的应急反应。

本品有以下特点:①全麻诱导快,苏醒迅速。②对呼吸道无刺激,适合小儿全麻诱导与维持。③肌松作用大于恩氟烷,异氟烷。④对循环影响小。⑤遇碱石灰不稳定,可产生潜在的毒性复合物。

**【体内过程】**本品部分在肝内代谢,代谢产物为葡萄糖醛酸六氟异丙醇,无机氟,二氧化碳和水。其代谢率略高于恩氟烷。本品大部分经肺以原形排泄,部分代谢产物随胆汁和尿排出。血浆半衰

期呈三相, $\alpha$ 相为2.7分钟, $\beta$ 相为9.04分钟, $\gamma$ 相为30.7分钟。

**【应用】**须备有准确精密的蒸发器才能使用本品。

1. 吸入全麻诱导浓度为4.5%,诱导时间为8~10分钟,麻醉维持浓度为1.5%~2.5%。

2. 适合门诊手术及对小儿和特殊检查病人的全麻。

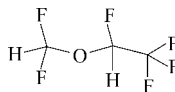
**【注意】**①对卤化麻醉药过敏者和恶性高热者禁用。②颅内占位性病变,颅脑损伤为避免颅内压继续升高,均应谨慎吸入全麻药。③重症肌无力慎用。④妊娠初期慎用。⑤肝胆疾病及肾功能低下慎用。⑥一个月内接受过全身麻醉,且有肝损害慎用。⑦本品可引起子宫肌松弛,产科麻醉时慎用。⑧冠心病患者慎用。

**【不良反应】**主要有血压下降,心律失常,恶心及呕吐等,发生率约13%;恶性高热,与损伤体温中枢有关;对呼吸,循环的抑制与麻醉深度有关;对肝肾功能的影响类似于恩氟烷。

溶液剂 120ml; 250ml

### 地氟烷

Desflurane



**【其他名称】**地氟醚,优宁

**【性状】**沸点较低(23℃),血/气分配系数为0.42,比其他含氟吸入麻醉药均低,故麻醉的诱导及苏醒均快,易于调节麻醉深度。

**【作用】**本品为吸入性麻醉药,结构与异氟烷相似。本品还可通过内源性血管扩张作用引起脑血流增加,易致颅内压显著升高。

本品的优点有①血组织溶解度低,麻醉诱导快,苏醒早,较目前使用的其他麻醉药更易调控;②体内生物转化少(0.02%~0.1%),对机体功能影响小;③对循环功能干扰小,更适用心血管手术麻醉;④遇碱石灰稳定;⑤肌松作用强于其他氟类吸入麻醉药。

本品的缺点是①沸点低(23.5℃),不能用标准蒸发器,需用电子温控的蒸发器,使蒸发器温度保持在23~25℃;②有一定的刺激性,诱导中可能会引起分泌物增多,咳嗽或屏气;③药效价低,价格昂贵;④不适宜于小儿全麻诱导。

**【应用】**须用专用蒸发器,单用12%~15%地

氟烷可引起下颌松弛,完成气管插管,维持6%~9%;平衡麻醉时,地氟烷吸入浓度可维持3%左右。

**【注意】**用于12岁以下儿童常发生咳嗽,屏气,呼吸暂停,喉痉挛和分泌物增多,不推荐用于小儿麻醉的吸入诱导。

**【不良反应】**本品可导致剂量依赖性血压下降和呼吸抑制,麻醉诱导时可出现咳嗽,屏气,分泌物增多,呼吸暂停和喉痉挛;可触发骨骼肌代谢亢进,导致氧耗增加,从而表现出恶性高热,高碳酸血症,肌肉强直,心动过速,紫绀,心律失常及血压不稳定。

溶剂 240ml; 250ml

## 氧化亚氮

Nitrous Oxide

$N_2O$

**【性状】**本品是一种无色,略带甜味的气体,相对密度1.53,尽管自身不燃烧,但与易燃麻醉药混合达适当浓度,则可起助燃作用。制品压缩液化后装在钢瓶中。

**【作用】**氧化亚氮无刺激性,镇痛作用强。其麻醉作用发生快、诱导迅速,停药后苏醒也快,麻醉时可使意识消失,反射受抑制。对中枢神经系统无毒性。对呼吸和循环无抑制作用,不影响肝肾功能。氧化亚氮是一种弱麻醉剂,单独应用本品与氧的混合物(80% $N_2O$ +20% $O_2$ ),只能达到麻醉三期一级,实际上一般认为氧化亚氮浓度不应超过70%。本品不引起骨骼肌松弛。

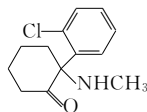
**【应用】**本品目前主要用于诱导麻醉或全身麻醉的辅助药物,可减少其他麻醉药的用量,因而使并发症的发生减少。

**【体内过程】**氧化亚氮应用后很快地从呼吸道排出,极少量通过皮肤弥散。

**【注意】**①氧化亚氮的血/气分配系数为氮的34倍,氧化亚氮可交换体内气腔中的氮,使这些部位的压力和容积增大。所以本品禁用于体内存在着气囊肿、肠胀气、气胸、气脑等患者;②术后大约有15%的病人发生恶心或呕吐;③氧化亚氮长期使用,可抑制骨髓生成白细胞和红细胞的功能;④手术室内大气中含氧化亚氮的浓度不应超过50ppm,以免工作人员长期在此环境中受到影响。⑤本品贮存于耐压钢瓶中。

## 氯胺酮

Ketamine



本品制品为氯胺酮的盐酸盐。

**【性状】**为白色结晶粉末,溶于水。

**【作用】**本品是一种静脉麻醉药。镇痛效应极强。成人做分离麻醉时,用量大约是1~2mg/(kg·min)(肌内注射4~6mg/kg后产生同样作用),分离感觉在15秒内出现,又30秒内意识消失。用1次剂量后,意识消失10~15分钟,镇痛维持约40分钟;明显遗忘1~2小时。如需要较长时间麻醉,可以用最初剂量的1/3或1/2补充用药。

本品的肌肉松弛作用差,有时肌张力反可增强;可发生无目的的活动,如睁眼凝视、呈木僵状态等。甚至偶可以见到对刺激发生强烈而无理智的反应。

在常用剂量下对呼吸影响不大,仍有喉反射,而咳嗽反射则受到抑制,动脉压可增加25%。心输出量和心率增加;眼内压也增高。

应用本品麻醉后,清醒常需要几小时,且常有噩梦、幻觉,发生意外行为,甚至在几天或几周后还可发生。

**【体内过程】**本品吸收快、分布容积大,清除快,连续给药不会显著延长作用时间,与血浆蛋白结合率较低。 $t_{1/2\beta}$ 为2~3小时。主要经肝代谢;90%经肾随尿排泄,5%经胆汁由粪排泄。

**【应用】**本品起效快、维持时间短。单独应用仅适合于不需肌肉松弛的短小诊断检查或小手术,烧伤换药或骨科手法复位。常用于全麻的诱导。

1. 全麻诱导 成人 **静注** 1~2mg/kg, 或 **肌内注射** 5~10mg/kg。

2. 全麻维持 成人 可采用**连续滴注**, 不超过1~2mg/min。遇有肌肉强直或阵挛,用量不必加大,轻微者均自行消失,重症应考虑加用苯二氮革类药物。

3. 镇痛 成人 先**静注** 0.2~0.75mg/kg, 2~3分钟注完,而后**连续滴注** 0.005~0.02mg/(kg·min),也可先**肌注** 2~4mg/kg,而后**静滴**。

4. 小儿基础麻醉 **肌注**: 1次4~8mg/kg,个体间差异大。

极量 **静脉注射**: 4mg/(kg·min)。**肌注**: 1次13mg/kg。

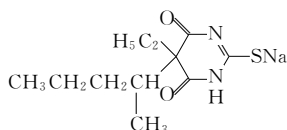
**【注意】**①禁用于高血压、颅内压升高和有精神疾病的病人。②可使眼内压升高、不适用于青光眼等多种眼科手术。③术后患者需要安静环境,避免外界刺激。

**【不良反应】**①几乎 30 岁以上的成人有半数可出现谵妄或兴奋,或有视觉障碍,容易出现在用药后 1 小时,苯二氮䓬类可减轻严重谵妄的发作。在儿童和青年,这种不良的精神感受的发生率大大减少;②恶心、呕吐;③噩梦、恐怖感等也较严重,可引起患者的强烈不适,增加术后处理的复杂性。用药后 24 小时内不能胜任需要思维的精密工作,包括驾车。

注射剂 0.1g/2ml; 0.1g/10ml; 0.2g/20ml

### 硫喷妥钠

Thiopental Sodium



**【其他名称】**戊硫巴比妥钠, Pentothal

**【性状】**本品为淡黄色粉末,具不快的气味。极易溶解于水,水溶液呈碱性。具引湿性。注射用硫喷妥钠中含 6% 的  $\text{Na}_2\text{CO}_3$ 。其水溶液不稳定,溶解后应尽早使用。

**【作用】**本品属短效巴比妥类,脂溶性高,极易透过血脑屏障而进入脑组织,故作用迅速。1 次静注后 10~20 秒后意识消失,进入麻醉状态,20~30 分钟内逐步减轻,直至意识恢复。无兴奋期。如用小剂量硫喷妥钠,可以见到兴奋反应,可能是当抑制性调节部位首先被抑制后从高级中枢释放出来的现象。

本品镇静作用差,用量不足时甚至可以增加对痛的敏感性。

本品不刺激呼吸道,但是咳嗽、喉痉挛甚至支气管痉挛时有发生。可产生剂量依赖性呼吸抑制,而且抑制可以很深。用药后脑血流量和脑代谢率均减少,颅内压明显降低。本品对子宫收缩无作用,但能透过胎盘抑制胎儿;主要在肝脏代谢,肾脏排泄。肝肾功能在大剂量时受到抑制。

**【应用】**本品常用于静脉麻醉,诱导麻醉,基础麻醉,抗惊厥以及复合麻醉。

1. 静脉麻醉 用灭菌注射用水溶解成 2.5% 溶液,徐徐注入,可产生短时间的麻醉,用量为 3~5mg/kg,至多不超过 6~8mg。静注时当先用小量(0.5~1.0mg/kg)做试探,证明患者对药物无特殊反应,才注入足量。患者对药物不敏感,术中出现苏醒(呼吸快、发声、移动等)可增量。但 1 次全麻过程中不得超过 20mg/kg,即成人极量为

1g/次。

**静滴**一般用 5% 葡萄糖注射液稀释至 0.2%~0.4% 溶液,滴速以每分钟 1~2ml 为度。

2. 基础麻醉 ①用于小儿体重 25 kg 以下者,肌注:一般用 2.5% 水溶液 15~20mg/kg,1 次不超过 0.5g。瘦弱者用量酌减。②甲亢及精神紧张成人,肌注:0.5g/次。注射部位可能出现无菌性坏死,应予注意。

3. 诱导麻醉 一般用 2.5% 溶液缓缓静注,1 次 0.3g(1 次不超过 0.5g),继给以吸入麻醉药。

4. 抗惊厥 一般用 2.5% 溶液,缓缓静注,每次 0.05~0.1g。

**【注意】**①巴比妥类药物存在交叉过敏;②耐药性个体差异大,用药需个体化;③应用的水溶液的浓度不应超过 2.5%。静注时切忌外泄,如注射到血管外,就可有严重疼痛和组织坏死。④复杂性哮喘、急性间歇性哮喘是巴比妥类应用的绝对禁忌证。因可促使周围神经和脑神经发生广泛范围的脱髓鞘和在中枢神经发生弥散性损害,造成疼痛、软弱和瘫痪,危及生命。⑤对颅内压增高、咽部感染、不稳定的动脉瘤或有哮喘者,有出血或其他类型低血容量,循环不稳定,脓毒症、毒血症或休克时均应慎用;⑥肝功能不良者亦应慎用;⑦安瓿已破裂、药物粉末不易溶解而有沉淀,溶液带颜色等均不宜再用。

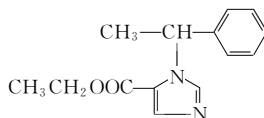
**【不良反应】**咳嗽、咽喉痉挛甚至支气管痉挛时有发生,原因还不清楚。注射宜缓慢或事前给予阿托品以预防。如出现呼吸微弱,乃至呼吸抑制,虽未达预定剂量,也应立即停止用药。可使外周阻力血管扩张,回心血流量减少,如出现血压降低,心搏出量减少时,可立即注射肾上腺素或麻黄碱。使用时必须备以气管插管、呼吸机及氧气。

**【相互作用】**①应用降压药者,静注巴比妥类药物应酌减量,且应缓慢注入,以免血压剧降,造成虚脱或休克。②与中枢抑制药合用时需减量,以免过度抑制中枢。③本品水溶液碱性强(pH11左右),应注意理化配伍禁忌。

注射剂(粉针) 0.5g; 1g

### 依托咪酯

Etomidate



本品制品为依托咪酯的硫酸盐。

**【性状】**白色结晶性粉末，极易溶于水。药用为具活性的右旋体。本品盐酸盐也供药用。

**【作用】**本品为非巴比妥类静脉麻醉药。在静脉注射后 20 秒后能产生快速而平稳的诱导麻醉，持续时间约 5 分钟。全麻作用比硫喷妥钠强 12 倍，较少导致呼吸暂停和心脏抑制，恢复较快。血压升降甚微，脉搏增减少见，周围血管阻力和冠状血管阻力明显降低，心脏指数反而增大。与硫喷妥钠、丙泊酚比，本品的最大优点是诱导后，患者的心血管系统功能稳定。适用于冠心病、心肌病及脑血管病患者的麻醉诱导。较少引起术后头痛。

**【体内过程】**本品静注后，迅速分布至脑和其他组织。蛋白结合率为 76.5%。在肝脏中代谢成无活性的代谢物。降解物 78% 经肾随尿排出（其中 3% 为原形），22% 随胆汁排出。 $t_{1/2}$  约为 4 小时。

**【应用】**本品用于诱导麻醉。

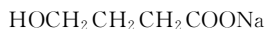
成人 **静注**：0.3mg/kg，于 15～60 秒内注入。

**【注意】**①约有 15%～30% 的病人注射时出现疼痛；②有 10%～65.5% 的病人可发生肌阵挛，部分是注射疼痛所致，但主要可能由于中枢作用引起。病人表现为骨骼肌僵硬、震颤甚至乱动；③如将本品作为氟烷的诱导麻醉剂，宜将氟烷的用量减少。

注射剂 20mg/10ml

### 羟丁酸钠

Sodium Oxybate



**【其他名称】** $\gamma$ -羟基丁酸钠，Sodium Hydroxybutyrate

**【性状】**本品为白色结晶性粉末，有吸湿性和咸味。溶于水，水溶液呈弱碱性。

**【作用】**本品为中枢神经活动的抑制物质。干扰突触部位冲动的传递，常用量作用于大脑皮层，超量时才影响到中脑以及脑干，引起类似睡眠的麻醉现象。

本品毒性小，缓缓静脉注射对呼吸和循环功能无明显影响。可使呼吸频率减慢，但呼吸量增加。高龄者应用较大剂量时有时出现间歇性呼吸。使用中有使心率减慢、血压上升的倾向。对肝肾功能无损害，不干扰电解质平衡，

氧耗量无增减。

单用本品可出现副交感神经功能亢进，呼吸道分泌物增多，大小便次数增加，因此，麻醉前应给予足量的阿托品。有些病人可出现肌肉震颤和手指不自主活动等锥体外系症状，常可自行消失，术前给予巴比妥类药物有预防作用。

本品无镇痛作用。全麻效能低，诱导期长，术后完全清醒需要较长时间。术中遇有强刺激，常出现谵妄，甚至有锥体外系阵挛样动作，对手术操作不利，必要时可用硫喷妥钠缓解。

**【体内过程】**本品静注后体内分布广泛。透过血脑屏障较慢，且脑组织中浓度仅为血浆浓度的 50%。因而起效慢。静注后 3～5 分钟出现嗜睡，5～10 分钟进入深睡，作用持续 90～120 分钟，有时持续 5～7 小时，很不一定。97% 代谢为水和二氧化碳，随呼吸排出体外，少量以原形经肾出现于尿中。

**【应用】**本品适用于全麻的诱导和维持。尤适用于小儿和老年人及脑、神经外科手术、外伤、烧伤的麻醉。

1. 全麻诱导 **静注**：1 次 60～80mg/kg，注射速度不超过 1g/min。

2. 全麻维持 **静注**：1 次 12～80mg/kg，小儿按 80～100mg/kg 给药。

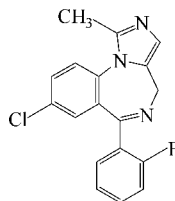
极量：一次总量为 300mg/kg。

**【注意】**①单用或静注太快可出现运动性兴奋。谵妄、肌肉抽动等。还可引起脉搏缓慢，可用阿托品拮抗，但又会出现呼吸频率减慢甚至停止。②能抑制氮的分解代谢，促进钾离子进入细胞内而引起血钾过低，故对于低血钾手术病人需同时给予钾盐。③严重高血压、心脏房室传导阻滞以及癫痫患者禁用。

注射剂 2.5g/10ml

### 咪达唑仑

Midazolam

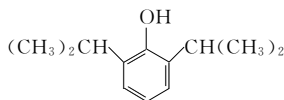


**【其他名称】**咪唑安定，速眠安，多美康

**【性状】**咪达唑仑的制品有马来酸盐和盐酸盐两种。本品用盐基计量，每 10.2mg 马来酸盐或 8.3mg 盐酸盐相当于咪达唑仑盐基 7.5mg。

## 丙泊酚

Propofol



【其他名称】普鲁泊福，异丙酚静安

【性状】本品为无色油状液体，在水中略溶。制品含本品1%，为O/W型乳，外观白色；含豆油100mg/ml，甘油22.5mg/ml和卵磷脂12mg/ml；以氢氧化钠调节pH为7.0~8.5；与血浆接近等渗。

【作用】本品为短效静脉麻醉药，适用于全身麻醉的诱导和维持。本品通过激活GABA受体-氯离子复合物，发挥镇静催眠作用。临床剂量时可增加氯离子传导，大剂量时使GABA受体脱敏，从而抑制中枢神经系统，产生镇静、催眠效应。起效快，作用时间短，苏醒迅速。能抑制咽喉反射、有利于插管、很少发生喉痉挛。诱导麻醉时一般比较平稳，极少出现刺激症状。因剂量大小和预先给药物的影响，也可产生低血压和一过性呼吸暂停。在恢复阶段，少数病人发生恶心、呕吐和头痛。本品不抑制肾上腺皮质激素的合成。

【体内过程】本品静注后约40秒入睡，8分钟苏醒，呼之能应。连续静滴可维持稳定的血浓度。丙泊酚体内过程符合三室模型。研究表明药物由中央室向外周室的分布迅速。药动学参数证明该药起效快，分布广，消除快，维持时间短，苏醒迅速。主要在肝脏代谢，88%代谢产物由尿排出。体内清除率快于肝脏血流，提示有肝外代谢，如肺、肾等脏器参与清除。在人体不产生急性耐受性，没有发现有蓄积作用。

【应用】适用于幼儿至老年各类手术病人，可广泛应用于诱导、维持和全身静脉复合麻醉，在ICU以及门诊手术麻醉中也成为首选药物之一。长时间输注无体内蓄积，停药后迅速清醒，具有良好的可控性。

1. 诱导麻醉 成人单次使用本品，小于55岁2.0~2.5mg/kg，大于55岁2.0mg/kg，缓慢静注(30~60秒)。

2. 维持麻醉 应个体化给药，连续输注，使血药浓度稳定在一个适当的水平。连续输注比单次给药时的心血管稳定性好。常用的方案有10/8/6输注法：先单次给予1mg/kg，并同时开始以103.75mg/(kg·h)的速度持续10分钟；再减至83.75mg/(kg·h)的速度持续10分钟；最后以63.75mg/(kg·h)的速度维持。这种方案可使血浆丙泊酚浓度达到3 $\mu$ g/ml。老年人用量应减少，采用复合麻醉时剂量应减少。

【作用】本品为相对短效的苯二氮䓬类中枢抑制剂，其中枢抑制作用依赖于给药剂量、途径以及是否合并用药。具有迅速的镇静和催眠作用，起效快、持续时间短。肌注或静注后可产生短暂的顺行性记忆缺失。它还具有抗焦虑、抗惊厥和肌肉松弛作用。对心血管及呼吸系统影响小。口服主要用于失眠症（详见第十三章），注射用于手术镇静等。

【体内过程】本品肌注后，15分钟开始作用，30~60分钟作用最强，静注后3~5分钟内达到镇静，在体内迅速分布， $t_{1/2}$ 为1.5~2.5小时，40%~50%由肝代谢。肌注生物利用度在90%以上。总血浆清除率为300~400ml/min。24小时内排泄近90%。尿中主要代谢物为 $\alpha$ -羟基咪达唑仑葡萄糖醛酸酯。

【应用】本品用于麻醉的诱导和维持，特别适用于短时间的手术和诊断。

1. 术前给药 术前2小时口服7.5~15mg或30~60分钟肌注 成人用量：0.1~0.15mg/kg。儿童：0.15~0.2mg/kg。在诱导麻醉前20~30分钟给药。成人可单独肌注，对术前疼痛患者可与抗胆碱药和镇痛药合用，儿童应与8mg/kg的氯胺酮合用。

2. 诊断与术前镇静 静注：0.05~0.1mg/kg，在手术前5~10分钟单独给药或与抗胆碱药合用。

3. 麻醉诱导 静注适用于做吸入麻醉中的诱导剂，本品无镇痛作用，应和镇痛药合用，通常用药后2~3分钟，可达到深睡眠状态，如不够，应按首次剂量的半量重复给药1次。成人剂量0.1~0.25mg/kg，儿童0.2mg/kg。

4. 麻醉维持 为继续保持理想的麻醉效果，应重复小剂量静注，剂量和间隔应个体化。

5. 重症病人的镇静 首次剂量0.03~0.1mg/kg，静注，总量不宜超过15mg。

6. 局部麻醉或椎管辅助用药分次静注0.03~0.04mg/kg。

【注意】①呼吸抑制较罕见，应注意减量或减速。②重症肌无力和对苯二氮䓬类过敏者禁用。③老年及患循环系统疾患的病人应慎用。④妊娠头3个月及哺乳的妇女不可应用。⑤给药后至少在12小时内不得驾驶机动车或操纵机器。

【相互作用】①与乙醇合用，起相加作用，在用本品后12小时内禁饮含酒精饮料。②本品能增强抗精神病药、安定药、抗抑郁药、镇痛药和麻醉药的中枢镇静作用。

片剂 7.5mg, 15mg(马来酸盐)

注射剂 2mg/2ml, 2mg/ml(盐酸盐); 5mg/ml; 15mg/5ml(马来酸盐)

3. 小儿麻醉 小儿的分布容积较大(小儿 0.52L/kg, 成人 0.27L/kg), 总清除率高, 按体重计算小儿需要较大的诱导剂量, 维持期的输注速率也较成人高, 才能达到合适的麻醉深度。年龄愈小, 按体重计算所需的剂量相对愈大。8 岁以上诱导量为 2.5mg/kg; 维持量 9~15mg/(kg·h)。

4. ICU 镇静 丙泊酚药代动力学特点符合 ICU 患者的镇静要求。给予每小时 1 mg/kg 的持续输注, 绝大部分时间(85%)可维持在理想的镇静程度, 患者安静, 可唤醒。小剂量输注对循环、呼吸无影响。本品在体内无积蓄, 长时间使用停药后能很快清醒。

**【注意】** ①禁用于对本品过敏的患者。②孕妇和哺乳妇女不宜使用。③3 岁以下儿童不宜用于全身麻醉。④本品一般不宜与其他药品配伍, 稀释剂各厂家产品要求不一, 应仔细阅读说明书。⑤室温贮存, 不得冷冻。使用前需轻轻摇晃, 使药物均匀。⑥只能用 5% 葡萄糖注射液稀释, 比例不能超过 1:5, 稀释后 6 小时内用完。

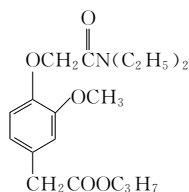
**【不良反应】** ①注射部位疼痛: 可注入上肢的大静脉, 并在局部使用利多卡因。②诱导期某些人有时可见打嗝和咳嗽; 低血压和短暂呼吸暂停。复苏期间, 少数患者有恶心、呕吐和头痛, 延长给药偶见尿变色。少见支气管痉挛、红斑和低血压等过敏反应。停用后, 偶会发生惊厥、肌阵挛、角弓反张, 极少数患者会延迟发生。术后有发烧的报道。

**【相互作用】** 和地西洋、咪达唑仑合用时延长睡眠时间, 阿片类药物增加其呼吸抑制。

注射剂 0.2g/20ml; 0.5g/50ml; 1g/100 ml

### 丙泮尼地

Propanidid



**【其他名称】** 普尔安, Epontol

**【性状】** 本品为黄色油状液体。微溶于水。

**【作用】** 本品为超短效非巴比妥类静脉麻醉药。作用迅速、持续时间短、全麻效能与硫喷妥钠相仿, 镇痛作用较弱。静注 5~7mg/kg, 20~30 秒后即失去意识, 深度麻醉持续 3~4 分钟。5~6 分钟后开始苏醒。醒后无头痛现象。对呼吸及循环系统有明显影响。呼吸先有 10~30 秒的增快过程, 以后则显弱、间断、并可暂停。此时部分病人(6%~9%)可有呃逆及不随意运动。血压一过性骤降(下降 30%), 高血压者降压更显著。心率增快、外周血管扩张。对肝、肾功能无明显影响, 但可促进组胺释放。

**【体内过程】** 临床制剂系用 20% Cremophos EL 溶解, 含本品 5% 的液体, 黏稠, 可用等量生理盐水稀释供用。

丙泮尼地在体内经血浆及肝中假胆碱酯酶水解成惰性代谢产物, 最后随尿排出, 2 小时可排出 90%。

**【应用】** 本品适用于 4~8 分钟的短小手术、检查、外科处置等麻醉。或用作诱导麻醉。

**静注:** 首次剂量 5~7mg/kg, 20 秒以上注完, 追加剂量为首次用量的 1/2~3/4, 可使麻醉时间延长 3~4 分钟。

**【注意】** ①过敏反应有血压急剧下降、出现红斑、浮肿、支气管痉挛, 最后导致呼吸循环功能障碍, 甚至心跳停止等表现, 需急救。②循环虚脱, 表现是血压下降、脉搏增快, 发展迅速。易发生于严重心功能不全、冠心病及休克等病人, 甚至引起心跳停止。并用 β-受体阻滞剂, 可引起完全房室传导阻滞。③注射部位可有血管痛。④Cremophos EL 即 Polyoxyl 35 Castor Oil(聚乙二醇 35 蓖麻油), 为非离子型表面活性剂, 可用于疏水性物质的增溶以配制注射液。注射时可选用较粗静脉, 以避免发生静脉炎。⑤偶可引起无意识的肌肉运动, 手指僵硬和震颤。⑥苏醒过程中常有恶心和呕吐。⑦溶血性贫血和肾脏损害的病人禁用。

注射剂 0.1g/2ml

### 其他全身麻醉药

药名	作用及应用	用法	注意
甲氧氟烷 Methoxyflurane	本品是吸入麻醉药中作用最强的、作用持续时间也长, 但因起效慢、苏醒也慢, 仅作为镇痛和维持基础麻醉用	吸入麻醉时浓度不得超过 1%	对肾有剧毒。禁用以聚氯乙烯为材质的麻醉器械

## 第二节 局部麻醉药

局部麻醉药(local anesthetics)简称局麻药。局麻药以适当浓度应用于身体局部神经末梢或神经干,可逆性地阻断神经冲动的传导,能在意识清醒状态下,使局部疼痛暂时消失。作用过后,神经功能完全恢复,对神经纤维或细胞不表现任何结构上的损害。

局麻药具体应用有:①局部浸润区域阻滞与局部止痛;②硬脊膜外阻滞、骶管阻滞与蛛网膜下腔阻滞;③外周神经干传导阻滞与牙科手术止痛,兼有运动麻痹;④表面局麻,主要用于眼、耳、鼻、喉科病人;⑤宫颈旁阻滞,主要用于妇产科病人;⑥阻滞心脏的冲动传递与心肌的应激,主要用于室性早搏或心律失常的治疗。

局麻药阻止神经冲动的发生与传导,其主要作用部位是细胞膜。除在外周神经系统发生作用外,也干扰所有器官发生冲动传导或冲动传递的功能。因此,它们对中枢神经系统、自主神经节、神经肌肉接点和所有类型肌纤维都可有一定作用。

### 普鲁卡因

Procaine



本品制品为普鲁卡因的盐酸盐。

【其他名称】奴佛卡因, Novocaine

【性状】白色结晶或结晶性粉末,无臭,味微苦,麻舌。在水中极易溶解,水溶液(1→20)的pH为5.0~6.0。

本品水溶液在pH3.3时最稳定。如pH升高则水解反应加速,生成对氨基苯甲酸(PABA),进一步氧化使溶液呈黄色。加热也可促进这一过程的进行。药典规定注射液中含PABA的量不能超过原料量的1.2%。

【作用】普鲁卡因于1905年问世,是第一个人工合成的局麻药,属氨基酯类。目前仅用于局部浸润麻醉,偶尔用于诊断性神经阻滞。因为他起效慢,作用弱,作用持续时间短。本品为水溶性局麻药,其毒性仅为可卡因的1/6~1/10,刺激性小。但对黏膜穿透力弱,不适用于鼻黏膜、眼等表面麻醉。本品无血管收缩作用,为防止迅速吸收,可加入少量肾上腺素(每次用量不超过0.3mg),以延长作用时间。

【体内过程】普鲁卡因在胃肠道外给药易被吸收,因而不能长时间地停留在注射部位。本品在血

浆中被胆碱酯酶迅速水解为对氨基苯甲酸和二乙氨基乙醇。静脉注射时,以原形从尿中排泄的量在2%以下(24小时内)。

普鲁卡因的水解主要发生在血浆中,而仅小部分在肝脏水解。因为脑脊液含有很少或没有酯酶,椎管内注射所产生的麻醉作用持久。

### 【应用】

1. 浸润麻醉 0.25%~0.5%溶液,每次用量0.05~0.25g,1次用药量不得超过1.0g。

2. 神经传导阻滞 1%~2%溶液,1次不超过1g。

3. 蛛网膜下腔阻滞(腰麻) 1次不超过0.15g。限于会阴区时,常用量为50mg(10%溶液,0.5ml);会阴和下肢,0.1g(5%或10%溶液,2ml或1ml);脊神经阻滞达肋缘,0.15~0.2g(3%或5%溶液,5ml或4ml)。

4. 普鲁卡因静脉滴注 用0.1%~0.2%盐酸普鲁卡因的等渗氯化钠溶液,静脉滴注。能使全麻药增效,可作为全麻的辅助用药。现已基本不用。

5. 止胃痛 通常每次10~20mg,与健胃药同服。

6. “封闭疗法” 0.25%~0.5%溶液注射于病变部位或有关的神经周围。用于治疗某些损伤和炎症,使症状得到一定缓解;还可用于纠正四肢血管舒缩功能障碍。

7. 治疗神经官能症 0.25%~0.5%溶液,每日静注1次,从5ml开始,每日增加1ml至10ml为止。

【注意】①用量过大或用浓溶液快速注入血管时,可能引起恶心、出汗、脉速、呼吸困难、颜面潮红、谵妄、兴奋、惊厥。所有含氮局麻药经吸收后,都可引起中枢神经系统兴奋,产生不安和震颤,可进展到阵挛性惊厥。紧随中枢兴奋之后就是抑制,死于呼吸衰竭。②高浓度时对心肌有一定作用。偶尔用本品小量进行浸润麻醉时,也可引起血管性虚脱和死亡。③腰麻时常出现血压下降,可在麻醉前肌注麻黄碱15~20mg预防。④极少数人对本品过敏,其表现可有过敏性皮炎,典型的哮喘发作或致死性的变态反应。用药前应询问病人过敏史,对过敏体质病人应做皮内试验(0.25%溶液0.1ml)。但反应阴性者仍有可能发生过敏反应。酯类局麻药可见交叉过敏。此时可考虑采用酰胺类局麻药。⑤添加肾上腺素,不适用于心脏病,包括心律失常、甲亢、高血压、外周血管瘤等患者。⑥临床上常将起效快而时效短的局麻药与起效慢、时效长的药物配合使用,但应格外注意两者毒性相加。

【相互作用】本品在体内水解,产生对氨基苯甲酸,具有抑制抗菌药物——磺胺的作用,应避免

两者同时合用。

注射剂 40mg/2ml; 100mg/10ml; 50mg/20ml; 100mg/20ml  
溶液剂 1%

### 氯普鲁卡因

Chloroprocaine



本品制品为氯普鲁卡因的盐酸盐。

【性状】为白色结晶性粉末， $pK_a$  8.7；溶于水（1:20）。

【作用】本品的药理性质与普鲁卡因几乎完全相同，主要优点是起效快，作用时间短，迅速被代谢（ $t_{1/2}$  约为 25 秒），麻醉强度至少是普鲁卡因的 2 倍，而毒性却较低。

【体内过程】本品被血浆胆碱酯酶迅速水解。作用时间约 1 小时。

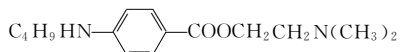
【应用】本品适用于

1. 浸润麻醉 0.5%~1% 溶液。
  2. 传导麻醉 2% 溶液。
- 1 次用量均不超过 1g。  
其他均参见普鲁卡因（p310）。

注射剂 1%；2%

### 丁卡因

Tetracaine



本品制品为丁卡因的盐酸盐。

【其他名称】地卡因，Dicaine

【性状】为白色结晶或结晶性粉末，有吸湿性，味苦而麻。易溶于水或冰醋酸中。

【作用】本品与普鲁卡因相比，脂溶性高，渗透力强，毒性和局麻作用比普鲁卡因强 10 倍。能穿透黏膜，作用迅速，1~3 分钟显效，持续时间 1~1.5 小时。随着布比卡因的问世，本品因用药量大，起效慢，毒性大已很少用于外周神经阻滞麻醉。

【体内过程】在体内大部分经肝代谢为对丁氨基苯甲酸与二甲氨基乙醇，进一步降解或结合后随

尿排出。由于代谢比较慢，因而毒性较大。

【应用】本品最常用于黏膜表面麻醉，也用于传导麻醉、腰麻和硬膜外麻醉。因毒性大，一般不用于浸润麻醉。

1. 腰麻 常用其混合液（1% 丁卡因、10% 葡萄糖与 3%~5% 盐酸麻黄碱等注射液各 1ml 混合），作用时间较长，上腹部手术可维持 1.5~2.5 小时，下腹部手术可维持 2.5~4 小时。

2. 硬膜外麻醉 0.15%~0.3% 本品溶液，与盐酸利多卡因合用时最高浓度为 0.3%。

3. 表面麻醉，创面镇痛 眼的表面麻醉用 0.5%~1% 溶液或软膏涂抹，鼻和咽喉黏膜用 2% 溶液；肛门、直肠镇痛可用软膏；0.25%~2% 溶液亦可用于口腔、气管黏膜麻醉。尿道不适合使用本品。

极量：浸润局麻，神经传导阻滞，1 次 0.1g。

【注意】①腰麻时可出现恶心、呕吐、头痛、血管运动麻痹、呼吸麻痹等。②有时可出现肌肉挛缩、呼吸不全、苍白、血压下降、虚脱。③过敏患者可出现流泪、羞明、结膜浮肿。④大剂量可致心脏传导系统和中枢神经系统出现抑制。⑤酯类局麻药可引起交叉过敏。

注射剂 20mg/2ml; 50mg/5ml; 15mg（粉针）; 20mg（粉针）

眼膏 0.5%；滴眼剂 0.5%；软膏 0.5%~1%  
溶液剂 0.25%~2%

### 丙美卡因

ProxVymetacaine



本品制品为丙美卡因的盐酸盐。

【其他名称】Proparacaine, Plcaine

【性状】白色或类白色结晶性粉末，无臭或几无臭。本品 1 份可溶于水 30 份。遇热或露置空气会变色，溶液露置空气将由黄变深棕而功效降低。

【作用】本品为酯类表面麻醉剂。麻醉强度略大于相同浓度的丁卡因，作用快。由于其结构不同于普鲁卡因和丁卡因，因而与其他局麻药之间无交叉过敏性，很少引起初期的刺激作用。不用于注射，因毒性太大。

【应用】本品适用于眼科局部表面麻醉。

1. 用于测定眼压 0.5% 溶液，1~2 滴，约 20 秒即可有充分麻醉效果，可维持 15 分钟，无散瞳作用。

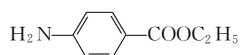
2. 用于白内障摘除 0.5%溶液, 每5~10分钟滴入1滴, 反复5~7次。

**【注意】** 偶有短暂的刺痛、灼痛和结膜发红或急性角膜炎。

溶液剂 0.5%

### 苯佐卡因

Benzocaine



**【其他名称】** 氨基甲酸乙酯, Ethyl Amino-benzoate

**【性状】** 无色棱状结晶或白色结晶性粉末、无臭、味麻, 在水中极微溶解(1:2500), 略溶于植物油(约1:40)。

**【作用】** 本品为酯类局部麻醉药, 刺激性及毒性较小, 毒性为可卡因的1/10, 适用于皮肤或黏膜的表面麻醉, 能麻痹感觉神经末梢, 麻醉力较可卡因、普鲁卡因弱, 吸收缓慢, 作用持久。本品吸收紫外线, 可用于防晒斑的乳剂或洗剂。

**【应用】** 本品适用于

1. 局部止痛、止痒 用于创伤、烧伤、耳科及牙科手术后疼痛, 5%~10%软膏, 混悬液。
2. 痔疮止痛 栓剂(0.2~0.3g)。
3. 治疗胃溃疡、胃炎等引起的疼痛 口服0.3~0.5g/次, 现已少用。

**【注意】** 本品会引起正铁血红蛋白血症。禁用于婴儿; 不可与磺胺药同用。

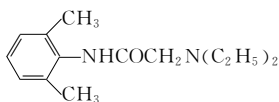
栓剂 0.2~0.3g

软膏剂 50%

溶液剂 20%

### 利多卡因

Lidocaine



本品制品为利多卡因的盐酸盐, 碳酸盐。

**【其他名称】** 赛罗卡因, Xylocaine, Lignocaine

**【性状】** 为白色结晶性粉末; 无臭, 味苦, 继有麻木感。在水中易溶。

本品水溶液较稳定, 热压灭菌8小时, 分解很少。在灭菌和贮藏条件下, 分解少于0.1%, 对酸碱亦较稳定。其原因在于酰胺键的邻位有两个甲基和侧链有两个乙基的空间位阻影响。

**【作用】** 本品为酰胺类局麻药, 与相同浓度的普鲁卡因比, 局麻作用起效快, 作用强而持久。局麻作用为普鲁卡因的2~4倍, 表面麻醉为盐酸丁卡因的1/2~1/3。本品穿透力也较强。局麻时效与药液浓度有关, 一般在1.5小时左右。对组织几乎无刺激性, 局部血管扩张作用不明显, 加入肾上腺素可延缓其吸收, 延长作用时间。本品安全范围较大, 能穿透黏膜。主要用于传导麻醉和硬膜外麻醉。因本品属酰胺类药物, 对普鲁卡因等酯类局麻药过敏的病人可改用本品。对磺胺类药物抑菌作用无影响。和青霉素水溶液混合不产生沉淀。其0.2%的溶液可作为青霉素溶剂, 用于肌肉注射, 以减少疼痛。

本品碳酸盐与盐酸盐比, 阻滞作用较强, 起效较快, 肌肉松弛较好, 麻醉持续时间无差异。

本品尚具抗心律失常作用, 详见抗心律失常药章。

**【体内过程】** 本品口服吸收虽好。但肝脏首先可使70%药物被代谢。利多卡因经肝脏微粒体的混合功能氧化酶作用, 脱去烃基分解为单乙基甘氨酸和二甲基苯胺, 后者仍具有一定的局麻和毒性作用。在人体约有75%二甲基苯胺进一步代谢为4-羟基-2,6-二甲基苯胺由尿排出。肌肉注射后30~40分钟, 血药浓度达峰值; 静脉注射时作用仅能维持10~20分钟。

本品可通过胎盘, 进入胎儿循环。

**【应用】** 本品用于局麻和抗心律失常。

1. 骶管阻滞 用于分娩镇痛, 成人用量以200mg(1%, 20ml)为度; 用于外科止痛可至225~300mg(1.5%, 15~20ml)。

2. 硬膜外阻滞 腰段, 镇痛200~300mg(1%, 20~30ml); 外科止痛225~300mg(1.5%~2%, 15~20ml); 胸段, 镇痛200~300mg(1%, 20~30ml)。

3. 浸润麻醉或静注区域阻滞 50~300mg(0.5%, 10~60ml)。

4. 外周神经阻滞 臂丛(单侧)或颈丛(双侧)225~300mg(1.5%, 15~20ml); 牙科, 20~100mg(2%, 1~5ml); 肋间神经(每支), 30mg(1%, 3ml); 宫颈旁浸润, 左右侧各100mg(1%, 10ml); 椎旁脊神经阻滞(每支), 30~50mg(1%, 3~5ml); 阴部神经, 左右侧各100mg(1%, 10ml)。1次量, 不超过400mg。

5. 交感神经阻滞 颈星状50mg(1%, 5ml); 腰50~100mg(1%, 5~10ml)。

6. 表面麻醉 1%~2%溶液适量涂布或喷雾,

1次不超过100mg。滴眼：成人用量4%溶液，每次1~5滴。

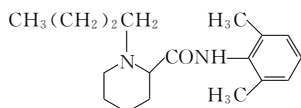
7. 作检查用，常用凝胶剂或胶浆剂，用法根据检查目的而定。

**【注意】**①肝功能不良病人，静注过快时，可出现思睡、头痛、视力模糊、感觉异常、肌肉抽搐、惊厥、呼吸停止。浸润麻醉时，如不并用麻黄碱，有时亦可出现思睡、倦怠等。②肾功能不全，肝供血不足时，药物的消除延缓，应减少用量。③误注入血管可引起急性中毒，表现为血压下降、苍白、恶心、呕吐、惊厥、呼吸困难、心跳骤停。但毒性比丁卡因低。④随剂量增加，出现的副作用包括嗜睡、耳鸣、味觉障碍、头晕和抽搐。进一步增加可出现癫痫发作、昏迷、呼吸抑制甚至停止。⑤严重房室传导阻滞、室内传导阻滞禁用。⑥凝胶剂适用于男性或女性的导尿管插入，膀胱镜检查前麻醉等。局部用药，打开后仅供使用1次。

注射剂 0.1g/5ml; 0.4g/20ml; 4mg/2ml  
凝胶剂 胶浆剂 2%  
喷雾剂或气雾剂 2%~4%

### 布比卡因

Bupivacaine



本品制品为布比卡因的盐酸盐。

**【其他名称】**丁吡卡因

**【性状】**白色结晶性粉末；无臭、味苦。在乙醇中易溶（1:10），水中溶解（1:30）。

**【作用】**本品于1963年问世，是应用较广泛的酰胺类局麻药，作用持久。与丁卡因比较，两者毒性相似，但本品作用持久。与利多卡因比，麻醉作用和毒性均强4倍。本品起效较慢，其0.25%~0.5%溶液起效时间一般为4~10分钟，但持续时间长（5~16小时），无快速耐受性。由于对感觉神经比运动神经有更好的阻滞作用，因而广泛用于分娩止痛和术后止痛。

**【体内过程】**本品使用常量后5分钟即能从血浆中检出，15~25分钟血药浓度达峰值。蛋白结合率为70%~90%。主要在肝脏先经脱羟后降解，有10%以原形或和葡糖醛酸结合后随尿排出。

**【应用】**本品主要用于局部麻醉和术后镇痛。

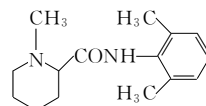
1. 浸润麻醉 0.1%~0.25%溶液。
2. 神经传导阻滞 0.5%~0.75%溶液。  
常用量 每公斤体重1~3mg/次。极量200mg/次，400mg/日。

**【注意】**①药液进入血液循环，尤其是自静脉进入心脏，可引起心搏骤停致死的危险，抢救需及时；②孕妇及12岁以下小儿慎用或勿用。③偶见精神兴奋、低血压、肌肉痉挛、震颤、心动徐缓、呼吸抑制、恶心、呕吐等。④肝、肾功能严重不全、低蛋白血症、对麻醉药过敏者忌用。⑤与碱性药物混合后，会发生沉淀。

注射剂 12.5mg/5ml; 25mg/5ml; 37.5mg/5ml; 150mg/20ml

### 甲哌卡因

Mepivacaine



本品制品为甲哌卡因的盐酸盐。

**【其他名称】**卡波卡因，Carbocaine

**【性状】**白色结晶性粉末，易溶于水。

**【作用】**本品是一种酰胺型局麻药。其化学结构和药理作用与利多卡因相似，作用开始较快，且较持久。

**【体内过程】**用C<sub>14</sub>标记的甲哌卡因对大鼠研究证明有两条代谢途径：N-去甲基和β-羟基化，在尿中检出β-羟基衍生物。静脉注射后24小时尿中测得55%的放射性，其中只有少量是放射性的原形药。β-羟基衍生物与葡糖醛酸结合排入胆汁，但在粪便中含量很低。

**【应用】**本品适用于

1. 浸润麻醉 0.25%~0.5%溶液。
2. 表面麻醉 1%~2%溶液。
3. 硬膜外麻醉 1.5%~2%溶液，首次注药量最少5ml，最多24ml。一般用量10~15ml。
4. 臂丛神经阻滞 1%溶液，总量为40ml；1.5%溶液30ml；2%溶液为20~24ml。

**【注意】**1. 本品能通过胎盘影响胎儿，对新生儿的毒性较大，故孕妇和产科忌用。

2. 偶见惊厥、肌肉抽搐、虚脱和低血压并可致死。

注射剂 200mg/20ml; 400mg/20ml