

脑科疾病 药理学

主 编：

周好田 程 立 刘香臣 等

脑 科 疾 病 药 物 学

主 编：周好田 程 立 刘香臣 等

吉林科学技术出版社

图书在版编目(CIP)数据

脑科疾病药理学/周好田等主编.—长春:吉林科学技术出版社,2009.6

ISBN 978-7-5384-4317-2

I. 脑… II. 周… III. 脑病-药物-临床应用 IV. R971

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2009)第 099516 号

脑科疾病药理学

主 编:周好田 程 立 刘香臣等

责任编辑:赵 鹏 刘宏伟 封面设计:方正

*

吉林科学技术出版社出版、发行

长春市东文印刷厂印刷

*

787×1092 毫米 16 开本 15.625 印张 250 千字

2009 年 6 月第 1 版 2009 年 6 月第 1 次印刷

定价:30.00 元

ISBN 978-7-5384-4317-2

社址:长春市人民大街 4646 号 邮编:130021

电话:0431-85630195

网址:www.jlstp.com 实名 吉林科学技术出版社

编 委 会

主 编:	周好田	程 立	刘香臣	孙心君	陈美荣	张令柱
	陈翠美	潘 清	王玉真	王爱娥	张蓉蓉	冯俊英
	邢 军	王祥生	周 雷	冯 慧	杜晓娅	李 杰
	李 峻	时 明	韩 军	赵凤英	张长刚	周世菊
	顾克斌	王兴征	朱来清	黄晓红	黄艳芳	高剑峰
副主编:	赵淑萍	崔爱环	李绪玲	李玉辉	王玉秋	隋凯峰
	刘洪强	郭金胜	吴 皓	李金德	张传芝	任巧玲
	任 敏	杨兴文	孙守景	张芝云	刘美兰	李秀英
	郭 勇	于 兰	李四劝	袁明华	孙秀娟	张 宇
	赵 健	黄建军	索 贞	赵万利	狄聪莲	
编 委:	宋 涛	唐爱玲	赵 勇	孙德强	付作辉	柳玉勇
	盛淑萍	荣海生	刘宪荣	陈成雨	韩凤珍	钱胜刚
	陈景清	韩 鹏	李 伟	赵雪茹	韩群英	翟爱玲
	王 琼	刘悦锋	薛宏亮	相其林	陈明来	步洪萍
	张建平	周福勤	战云鹤	李桂松	刘茂祥	范继美

前 言

为提高广大医药工作者的用药水平，促进临床合理用药，我们组织有关专家编写了《脑科疾病药物学》。本书从脑科疾病常用药物的药理作用、药效学、药代动力学、适应症、用法用量、不良反应、禁忌、注意事项、特殊人群用药、药物相互作用、剂型、规格等作了介绍。

由于医药学的飞速发展，药学理论不断完善，在应用脑科疾病药物时，还应参考新的资料和药品说明书。再者，由于编者拥有的资料与学识水平有限，书中难免有不当之处，敬请读者和有关专家不吝赐教，以便修订完善。

编 者

于山东省安康医院

二〇〇九年四月

目 录

第一章 抗精神病药	1	舒托必利	23
第一节 吩噻嗪类	1	奈莫必利	23
氯丙嗪	1	瑞莫必利	24
奋乃静	2	曲美托嗪	25
氟奋乃静	3	莫沙帕明	25
三氟拉嗪	4	佐替平	25
硫利达嗪	5	氯噻平	26
丙氯拉嗪	6	奥昔哌汀	26
三氟丙嗪	6	吗茚酮	26
乙酰丙嗪	7	第五节 长效抗精神病药	26
美索达嗪	7	哌泊噻嗪棕榈酸酯注射液	26
第二节 丁酰苯类	7	五氟利多	27
氟哌啶醇	7	氟哌噻吨癸酸酯注射液	28
氟哌利多注射液	8	癸氟奋乃静	29
三氟哌多	9	癸氟哌啶醇	30
替米哌隆	10	氯哌噻吨癸酸酯	30
匹莫齐特	11	氟司必林	30
第三节 硫杂蒽类	11	氟奋乃静庚酸酯	31
氯普噻吨	11	哌泊噻嗪十一烯酸酯	31
珠氯噻醇	12	第二章 抗躁狂药	32
珠氯噻醇醋酸酯注射液	14	碳酸锂片	32
氟哌噻吨	15	第三章 抗抑郁药	34
氟哌噻吨美利曲辛	15	盐酸丙咪嗪	34
氯哌噻吨	16	盐酸氯米帕明	35
替沃噻吨	16	盐酸阿米替林	36
第四节 其他抗精神病药	16	盐酸马普替林	37
舒必利	16	米安色林	38
硫必利	17	吗氯贝胺	39
利培酮	18	马来酸氟伏沙明	40
氯氮平	20	盐酸氟西汀	41
奥氮平	21	盐酸帕罗西汀	41
丁二酸洛沙平	23	盐酸舍曲林	42

盐酸曲唑酮	43	氟硝西洋	71
苯丙胺	44	去甲西洋	71
盐酸哌甲酯	45	氟地西洋	72
匹莫林	46	哈拉西洋	72
盐酸多塞平	47	依替唑仑	72
异卡波胂	48	氟他唑仑	73
盐酸文拉法辛	49	噁唑仑	73
盐酸安非他酮	50	美沙唑仑	73
曲米帕明	50	氟托西洋	74
阿莫沙平	51	溴西洋	74
托洛沙酮	51	氯氟卓乙酯	74
茛达品	52	二钾氯氮卓	75
米氮平	52	氯噁唑仑	75
苯乙胂	53	半琥珀酸布酰胺	75
反苯环丙胺	54	依替福辛	76
哌苯甲醇	54	苯佐他明	76
度硫平	54	第五章 镇静催眠药及抗惊厥药	77
地昔帕明	55	第一节 苯二氮卓类	77
卡匹帕明	55	夸西洋	77
普罗替林	55	卤噁唑仑	77
去甲替林	55	溴替唑仑	78
诺米芬新	56	咪达唑仑	78
奥匹哌醇	56	第二节 巴比妥类	79
第四章 抗焦虑药	57	苯巴比妥片	79
氯氮卓片	57	苯巴比妥钠	81
地西洋	58	异戊巴比妥	82
奥沙西洋	60	注射用异戊巴比妥钠	84
氯硝西洋	61	司可巴比妥钠	85
氟西洋	62	第三节 其他类催眠药	87
劳拉西洋	63	佐匹克隆片	87
三唑仑	64	酒石酸唑吡坦	88
艾司唑仑	65	水合氯醛	89
阿普唑仑	67	天麻素	90
甲丙氨酯	68	三溴片	90
盐酸羟嗪	69	戊巴比妥钠片	90
氯美扎酮	69	格鲁米特	91
盐酸丁螺环酮	70	甲喹酮	92
谷维素	71	密环菌	92

替马西泮	92	丙戊酰胺	125
度氟西泮	92	卤加比	125
氯普唑仑	93	氨己烯酸	125
替吡度尔	93	非氨酯	126
氯美噻唑	93	唑尼沙胺	126
三氯福司	94	舒噻嗪	127
溴化钾	94	青阳参总甙	127
副醛	94	抗痫灵	128
第六章 抗震颤麻痹药	95	贝克拉胺	128
左旋多巴	95	苯琥胺	128
卡比多巴	97	三甲双酮	128
甲磺酸溴隐亭	97	第八章 抗痛风药	129
甲磺酸培高利特	99	丙磺舒	129
吡贝地尔	100	苯溴马隆	130
盐酸司来吉兰	100	秋水仙碱片	130
托卡朋	101	别嘌醇	132
盐酸苯海索	104	磺吡酮	132
盐酸金刚烷胺	105	第九章 影响脑血管、脑代谢及促智药	133
苄丝肼	106	第一节 脑血管药	133
罗匹尼罗	106	尼莫地平	133
普拉克索	106	氟桂利嗪	134
美金刚	108	环扁桃酯	135
苯扎托品	108	降纤酶	135
丙环定	108	巴曲酶注射液	136
比哌立登	108	盐酸倍他司汀	138
普罗吩胺	109	盐酸罂粟碱	138
二乙嗪	109	己酮可可碱	139
第七章 抗癫痫药	110	烟酸占替诺	140
苯妥英钠	110	丁咯地尔	141
卡马西平	112	尼麦角林	141
奥卡西平	114	川芎嗪	142
托吡酯	115	奥扎格雷钠	143
乙琥胺	116	曲克芦丁	143
丙戊酸钠	117	维生素 E 烟酸酯	144
拉莫三嗪	119	灯盏花素	145
加巴喷丁	123	盐酸地芬尼多	145
扑米酮	123	长春胺	145
香草醛	124	长春西汀	146

萘呋胺	146	第十一章 镇痛药	167
第二节 脑代谢及促智药	147	吗啡	167
盐酸多奈哌齐	147	哌替啶	169
石杉碱甲	149	美沙酮	170
吡拉西坦	149	芬太尼	171
银杏叶提取物	150	丁丙诺啡	173
双氢麦角碱	150	二氢埃托啡	174
阿米三嗪萝巴新	151	氨酚羟考酮	175
吡硫醇	152	喷他佐	176
小牛血去蛋白提取物肠溶片	152	异丙吡仑	178
胞磷胆碱钠	152	布桂嗪	178
单唾液酸四己糖神经节苷脂钠注射液	153	舒马普坦	179
脑蛋白水解物	154	佐米曲普坦	181
注射用盐酸赖氨酸	154	曲马多	181
利斯的明	155	四氢帕马丁	182
艾地苯醌	155	罗通定	183
第十章 中枢兴奋药	157	奈福泮	183
尼可刹米	157	麦角胺咖啡因	184
洛贝林	157	千金藤啶碱	185
戊四氮	158	高乌甲素	185
贝美格	158	阿法罗定	186
麦角胺咖啡因	159	阿芬太尼	186
盐酸多沙普仑	160	苏芬太尼	186
二甲弗林	161	地佐辛	186
甲氯芬酯	161	苯噻啶	187
吡硫醇	162	美普他酚	187
胞磷胆碱钠	162	氟吡汀	187
土的宁	163	眼镜蛇毒	188
一叶萩碱	163	白屈菜碱	188
细胞色素 C	164	麦角胺	188
氨酪酸注射液	164	3-乙乌头碱	189
氨乙异硫脲	165	阿片全碱	189
醋谷胺	165	荷包牡丹碱	189
二氧化碳	166	山豆碱	189
氨	166	匹米诺定	190
氧	166	西马嗪	190
香草二乙胺	166	复方白屈菜酊	190
		第十二章 解热、镇痛抗炎药	191

阿司匹林	191	金诺芬	222
卡巴匹林钙	193	卫矛醇	223
水杨酸镁	194	乙水杨胺	223
双水杨酯	195	羟布宗	224
二氟尼柳	195	氯芬那酸	224
水杨酸咪唑	196	单氯芬那酸	225
对乙酰氨基酚	197	氟芬那酸	225
复方对乙酰氨基酚	198	甲芬那酸	226
贝诺酯	199	苋达明	227
吲哚美辛	199	氟比洛芬	227
阿西美辛	201	非诺洛芬钙	228
桂美辛	202	醋氯芬酸	229
双氯芬酸钠	202	美索巴莫	230
甲氯芬那酸	203	阿司匹林精氨酸盐	230
舒林酸	204	阿司匹林赖氨酸	230
丁苯羟酸	205	三柳胆镁	231
酮咯酸氨丁三醇	206	双氯芬酸	231
萘普生	207	依托度酸	231
布洛芬	208	非诺洛芬	233
酮洛芬	209	环氯茛酸	233
芬布芬	210	托美汀	233
奥沙普秦	211	吡洛芬	234
吡罗昔康	212	阿西美辛	234
美洛昔康	213	塞来昔布	234
氯诺昔康	214	罗非昔布	235
可塞风	214	阿明洛芬	236
奈科明	215	豆腐果甙	236
尼美舒利	216	异丙安替比林	236
安乃近	217	依匹唑	237
保泰松	218	卡洛芬	237
非普拉宗	219	非诺洛芬钙	237
萘丁美酮	219	洛索洛芬	238
来氟米特	220	强筋松	239
青藤碱	222	夫洛非宁	239

第一章 抗精神病药

第一节 吩噻嗪类

氯丙嗪

【药理作用】本品为吩噻嗪类抗精神病药,其作用机制主要与其阻断中脑边缘系统及中脑皮层通路的多巴胺受体(DA₂)有关。对多巴胺(DA₁)受体、5-羟色胺受体、M-型乙酰胆碱受体、 α -肾上腺素受体均有阻断作用,作用广泛。此外,本品小剂量时可抑制延脑催吐化学感受区的多巴胺受体,大剂量时直接抑制呕吐中枢,产生强大的镇吐作用。抑制体温调节中枢,使体温降低,体温可随外环境变化而改变,其阻断外周 α -肾上腺素受体作用,使血管扩张,引起血压下降,对内分泌系统也有一定影响。

【药代动力学】口服吸收好,1~3小时达血药浓度峰值。本品有“首过”效应。血浆蛋白结合率90%以上。易透过血-脑屏障,颅内药物浓度高4~5倍。在肝脏代谢,主要以代谢物形式从尿和粪便中排出。半衰期为12~36小时。

【适应证】(1)对兴奋躁动、幻觉妄想、思维障碍及行为紊乱等阳性症状有较好的疗效。用于精神分裂症、躁狂症或其他精神病性障碍。(2)止呕,各种原因所致的呕吐或顽固性呃逆。

【用法用量】

口服用于精神分裂症或躁狂症,从小剂量开始,一次25~50mg,一日2~3次,每隔2~3日缓慢逐渐递增至一次25~50mg,治疗剂量一日400~600mg。用于其他精神病,剂量应偏小。体弱者剂量应偏小,应缓慢加量。用于止呕,一次12.5~25mg,一日2~3次。

【不良反应】(1)常见口干、上腹不适、食欲缺乏、乏力及嗜睡。(2)可引起体位性低血压、心悸或心电图改变。(3)可出现锥体外系反应,如震颤、僵直、流涎、运动迟缓、静坐不能、急性肌张力障碍。(4)长期大量服药可引起迟发性运动障碍。(5)可引起血浆中泌乳素浓度增加,可能有关的症状为溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经。(6)可引起中毒性肝损害或阻塞性黄疸。(7)少见骨髓抑制。(8)偶可引起癫痫、过敏性皮疹或剥脱性皮炎及恶性综合征。

【禁忌】基底神经节病变、帕金森病、帕金森综合征、骨髓抑制、青光眼、昏迷及对吩噻嗪类药物过敏者。

【注意事项】(1)患有心血管疾病(如心衰、心肌梗死、传导异常)慎用。(2)出现迟发性运动障碍,应停用所有的抗精神病药。(3)出现过敏性皮疹及恶性综合征应立即停药并进行相应的处理。(4)用药后引起体位性低血压应卧床,血压过低可静脉滴注去甲肾上腺素,禁用肾上腺素。(5)肝、肾功能不全者应减量。(6)癫痫患者慎用。(7)应定期检查肝功能与白细胞计数。(8)对晕动症引起的呕吐效果差。(9)用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。(10)不适用于有意识障碍的精神异常者。

特殊人群

【孕妇及哺乳期妇女用药】孕妇慎用。哺乳期妇女使用本品期间停止哺乳。

【儿童用药】6岁以下儿童慎用。6岁以上儿童酌情减量。

【老人用药】从小剂量开始,缓慢加量,应视病情酌减用量。

【药物相互作用】(1)本品与乙醇或其他中枢神经系统性抑制药合用时中枢抑制作用加强。(2)本品与抗高血压药合用易致体位性低血压。(3)本品与舒托必利合用,有发生室性心律失常的危险,严重者可致尖端扭转心律失常。(4)本品与阿托品类药物合用,不良反应加强。(5)本品与碳酸锂合用,可引起血锂浓度增高。(6)抗酸剂可以降低本品的吸收,苯巴比妥可加快其排泄,因而减弱其抗精神病作用。(7)本品与单胺氧化酶抑制剂及三环类抗抑郁药合用时,两者的抗胆碱作用加强,不良反应加重。

【药物过量】中毒症状:(1)表情淡漠、烦躁不安、吵闹不停、昏睡,严重时可出现昏迷。(2)严重锥体外系反应。(3)心血管系统:心悸,四肢发冷,血压下降,直立性低血压,持续性低血压休克,并可导致房室传导阻滞及室性早搏甚至心跳骤停。处理:(1)超剂量时,立即刺激咽部,催吐。在6小时内须用1:5000高锰酸钾液或温开水洗胃,本品易溶于水,而且能抑制胃肠蠕动,故必须反复用温水洗胃,直至胃内回流液澄清为止。因本品镇吐作用强,故用催吐药效果不好。(2)注射高渗葡萄糖液注射液,促进利尿,排泄毒物,但输液不宜过多,以防心力衰竭和肺水肿。(3)依病情给予对症治疗及支持疗法。

【贮藏】遮光,密封保存。

【剂型规格】片剂(1)25mg(2)50mg;注射剂(1)1ml:10mg(2)1ml:25mg(3)1ml:50mg

奋乃静

【药理作用】本品为吩噻嗪类的哌嗪衍生物,药理作用与氯丙嗪相似,抗精神病作用主要与其阻断与情绪思维的中脑边缘系统及中脑—皮层通路的多巴胺受体(DA₂)有关,而阻断网状结构上行激活系统的 α -肾上腺素受体,则与镇静安定作用有关。本品镇吐作用较强,镇静作用较弱。

【药代动力学】口服后分布至全身,经胆汁排泄,部分在肠道中重吸收,半衰期($t_{1/2}$)为9小时。本品可通过脐血进入胎儿,也可从母乳中排出。本品具有高度的亲脂性与蛋白结合率。小儿与老龄者对本品的代谢与排泄均明显降低。

【适应证】(1)对幻觉妄想、思维障碍、淡漠木僵及焦虑激动等症状有较好的疗效。用于精神分裂症或其他精神病性障碍。因镇静作用较弱,对血压的影响较小。适用于器质性精神病、老年性精神障碍及儿童攻击性行为障碍。(2)止呕,各种原因所致的呕吐或顽固性呃逆。

【用法用量】

口服 治疗精神分裂症,从小剂量开始,一次2~4mg,一日2~3次。以后每隔1~2日增加6mg,逐渐增至常用治疗剂量一日20mg。维持剂量一日10~20mg。用于止呕,一次2~4mg,一日2~3次。

【不良反应】(1)主要有锥体外系反应,如:震颤、僵直、流涎、运动迟缓、静坐不能、急性肌张力障碍等。长期大量服药可引起迟发性运动障碍。(2)可引起血浆中泌乳素浓度增加,可能有关的症状为:溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经。可出现口干、视物模糊、乏力、头晕、心动

过速、便秘、出汗等。(3)少见的不良反应有体位性低血压,粒细胞减少症与中毒性肝损害。偶见过敏性皮疹及恶性综合征。

【禁忌】基底神经节病变、帕金森病、帕金森综合征、骨髓抑制、青光眼、昏迷、对吩噻嗪类药过敏者。

【注意事项】(1)患有心血管疾病(如心衰、心肌梗死、传导异常)应慎用。(2)出现迟发性运动障碍,应停用所有的抗精神病药。(3)出现过敏性皮疹及恶性综合征应立即停药并进行相应的处理。(4)肝、肾功能不全者应减量。(5)癫痫患者应慎用。(6)应定期检查肝功能与白细胞计数。(7)用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。

特殊人群

【孕妇及哺乳期妇女用药】孕妇慎用。哺乳期妇女使用本品期间应停止哺乳。

【儿童用药】12岁以下儿童用量尚未确定。

【老人用药】按情况酌减用量,开始使用剂量要小,缓慢加量。

【药物相互作用】(1)本品与乙醇或中枢神经抑制药,尤其是与吸入全麻药或巴比妥类等静脉全麻药合用时,可彼此增效。(2)本品与苯丙胺类药合用时,由于吩噻嗪类药具有 α 肾上腺素受体阻断作用,后者的效应可减弱。(3)本品与制酸药或止泻药合用,可降低口服吸收。(4)本品与抗惊厥药合用,不能使抗惊厥药增效。(5)本品与抗胆碱药合用,效应彼此加强。(6)本品与肾上腺素合用,可导致明显的低血压和心动过速。(7)本品与胍乙啶类药物合用时,后者的降压效应可被抵消。(8)本品与左旋多巴合用时,后者可抑制前者的抗震颤麻痹效应。(9)本品与单胺氧化酶抑制药或三环类抗抑郁药合用时,两者的抗胆碱作用可相互增强并延长。

【药物过量】中毒症状(1)中枢神经系统:有烦躁不安、失眠等兴奋症状。对有惊厥史者,尤其是儿童应特别注意,易产生四肢震颤、下颌抽动、言语不清等。(2)心血管系统:心悸,四肢发冷,血压下降,直立性低血压,持续性低血压休克,并可导致房室传导阻滞及室性过早搏动,可致心跳骤停。处理(1)如服用大量本品,立即刺激咽部,催吐。在6小时内用1:5000高锰酸钾液或温开水洗胃,本品易溶于水,而且能抑制胃肠蠕动,故必须反复洗胃,直至胃内回流液澄清为止。因本品镇吐作用强,故用催吐药效果不好。(2)静脉注射高渗葡萄糖注射液,促进利尿,排泄毒物,但输液不宜过多,以防心力衰竭和肺水肿。(3)依病情给予对症治疗及支持疗法。

【贮藏】遮光,密封保存。

【剂型规格】片剂(1)2mg (2)4mg;注射剂 1ml:5mg

氟奋乃静

【药理作用】本品属哌嗪类吩噻嗪,抗精神病作用主要与其阻断脑内的多巴胺受体有关,抑制网状结构上行激活系统而有镇静作用。止吐和降低血压作用较弱。

【药代动力学】口服吸收好,在肝脏代谢,活性代谢产物为亚砷基-N-羟基衍生物,半衰期为13~24小时。本品具有高度亲脂性与高度的蛋白结合率,并可通过胎盘屏障进入胎血循环,亦可分泌入乳汁,小儿、老龄者对本品的代谢与排泄均降低。

【适应证】用于各型精神分裂症,有振奋和激活作用,适用于单纯型、紧张型及慢性精神分裂症,缓解情感淡漠及行为退缩等症状。

【用法用量】

口服。从小剂量开始,每次 2mg,一日 2~3 次。逐渐增至一日 10~20mg,高量为一日不超过 30mg。

【不良反应】锥体外系反应多见,如静坐不能、急性肌张力障碍和类帕金森病。长期大量使用可发生迟发性运动障碍。可发生心悸、失眠、乏力、口干、视物模糊、排尿困难、便秘、溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经等。少见思睡、躁动、眩晕、尿潴留。偶见过敏性皮疹、白细胞减少及恶性综合征。偶可引起体位性低血压、心悸或心电图改变、中毒性肝损害或阻塞性黄疸、骨髓抑制、癫痫。

【禁忌】基底神经节病变、帕金森病、帕金森综合征、骨髓抑制、青光眼、昏迷及对吩噻嗪类药物过敏者。

【注意事项】(1)患有心血管疾病(如心衰、心肌梗死、传导异常)应慎用。(2)出现迟发性运动障碍,应停用所有的抗精神病药。(3)出现过敏性皮疹及恶性综合征应立即停药并进行相应的处理。(4)肝、肾功能不全者应减量。(5)癫痫患者慎用。(6)应定期检查肝功能与白细胞计数。(7)用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。

特殊人群

【孕妇及哺乳期妇女用药】孕妇慎用。哺乳期妇女使用本品期间应停止哺乳。

【儿童用药】6 岁以下儿童禁用。6 岁以上儿童酌情减量。

【老人用药】从小剂量开始。视病情酌减用量,以减少锥体外系反应及迟发性运动障碍的发生。

【药物相互作用】(1)本品与乙醇或其他中枢神经系统抑制药合用,中枢抑制作用加强。(2)本品与抗高血压药合用易致体位性低血压的危险。(3)本品与舒托必利合用,有发生室性心律失常的危险,严重者可致尖端扭转型心律失常。(4)本品与阿托品类药物合用,不良反应加重。(5)本品与锂盐合用,可引起意识丧失。

【药物过量】中毒症状:超剂量可致严重的锥体外系反应,主要表现为角弓反张,扭转痉挛、强烈震颤,运动不能,吞咽困难等。处理:立即停药,吞服大量药物者应及时洗胃,并依病情给予对症治疗及支持疗法。

【贮藏】遮光,密封保存。

【剂型规格】片剂 2mg;注射剂 2ml:10mg

三氟拉嗪

【性状】本品为糖衣片,除去糖衣后显白色。

【药理作用】本品为吩噻嗪类抗精神病药,抗精神病作用与其阻断脑内多巴胺受体有关,抑制延脑催吐化学感受区的多巴胺受体及直接抑制呕吐中枢,产生强大镇吐作用,镇静作用和抗胆碱作用较弱。

【药代动力学】口服吸收好,在肝脏代谢,主要活性代谢产物为硫氧化物,N-去甲基和 7-羟基代谢物,半衰期约为 13 小时。

【适应证】用于各型精神分裂症,具有振奋和激活作用,适用于紧张型的木僵症状及单纯型与慢性精神分裂症的情感淡漠及行为退缩症状。

【用法用量】

口服。从小剂量开始,一次 5mg,一日 2~3 次。每隔 3~4 日逐渐增至一次 5~10mg,一日 2~3 次。日剂量为 15~30mg,高量为一日 45mg。

【不良反应】锥体外系反应多见,如静坐不能、急性肌张力障碍和类帕金森病。长期大量使用可发生迟发性运动障碍。可发生心悸、失眠、乏力、口干、视物模糊、排尿困难、便秘、溢乳、男子女性化乳房、月经失调、闭经等。少见思睡、躁动、眩晕、尿潴留。偶见过敏性皮疹、白细胞减少及恶性综合征。偶可引起体位性低血压、心悸或心电图改变、肝酶水平升高或阻塞性黄疸、癫痫。

【禁忌】基底神经节病变、帕金森病、帕金森综合征、骨髓抑制、青光眼、昏迷及对吩噻嗪类药物过敏者。

【注意事项】1.患有心血管疾病(如心衰、心肌梗死、传导异常)应慎用。2.出现迟发性运动障碍,应停用所有的抗精神病药。3.出现过敏性皮疹及恶性综合征应立即停药并进行相应的处理。4.肝、肾功能不全者应减量。5.癫痫与脑器质性疾病患者慎用。6.应定期检查肝功能与白细胞计数。7.用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。

特殊人群

【孕妇及哺乳期妇女用药】孕妇慎用。哺乳期妇女使用本品期间应停止哺乳。

【儿童用药】6 岁以下儿童禁用。6 岁以上儿童易发生锥体外系症状,酌情减量。

【老人用药】老年患者应小剂量开始,视病情酌减用量,以减少锥体外系反应及迟发性运动障碍的发生。

【药物相互作用】1.与乙醇或其他中枢神经系统抑制药合用,可增强中枢抑制作用。2.与抗高血压药合用,易致体位性低血压。3.本品与舒托必利合用有增加室性心律失常危险,严重者可致尖端扭转心律失常。4.本品与其他阿托品类药物合用,不良反应相加。

【药物过量】中毒症状 1.中枢神经系统:可出现严重的锥体外系症状,并有意识障碍,从嗜睡、注意力不集中到昏睡,最后进入昏迷。检查时可发现瞳孔缩小,对光反射迟钝,同时伴有中枢性体温过低。2.心血管系统:体位性低血压、心率加快、脉细数、偶见心律不齐,严重时导致低血容量性休克。3.血液系统:中性粒细胞减少、过敏性紫癜。处理:洗胃,导泻,输液,并依病情给予对症治疗及支持疗法。

【贮藏】遮光,密封保存。

【规格】(1)1mg;(2)5mg

【剂型】片剂

硫利达嗪

【性状】本品为糖衣片,除去糖衣后,显白色或类白色。

【药理作用】本品为吩噻嗪类抗精神病药,抗精神病作用主要由于阻断脑内多巴胺受体,对锥体外系统多巴胺受体作用及体温中枢影响较弱,镇静作用也较弱。

【药代动力学】口服生物利用度约 40%,血药浓度达峰时间为 1~4 小时, $T_{1/2}$ 为 21 小时,血浆蛋白结合率达 99%,主要在肝脏代谢,从尿及粪便中排出。

【适应证】急、慢性精神分裂症及儿童多动症。

【用法用量】

口服。开始剂量为一次 25mg,一日 3 次。每隔 2~3 日每次增加 25mg,逐渐增加至最佳效应剂量。1~5 岁每日 1mg/kg,5 岁以上每日 5~15mg,分次服。

【不良反应】常见不良反应有口干、心动过速、视物模糊等。也可见嗜睡、头晕、鼻塞、体位性低血压,偶有腹泻、腹胀、心电图异常中毒性肝损害,长期用药可引起色素性视网膜病变,大多停药后消失。较少引起震颤、流涎、运动迟缓、静坐不能和急性肌张力障碍等锥体外系不良反应。

【禁忌】(1)严重心血管疾病如心衰、心肌梗死、传导异常等患者禁用。(2)昏迷、白细胞减少者禁用。(3)对吩噻嗪类及本品过敏者禁用。

【注意事项】(1)肝、肾功能不全者、癫痫病患者慎用。(2)出现过敏性皮炎者应停用。(3)出现恶性症状群应立即停药并进行相应的处理。(4)用药期间应定期检查肝功能、心电图、白细胞计数。(5)用药期间不宜驾驶机动车、操作机械或高空作业。

特殊人群

【孕妇及哺乳期妇女用药】孕妇慎用,哺乳期妇女使用本品时应停止哺乳。

【儿童用药】一日 1mg/kg 体重,分 2~3 次口服。

【老人用药】应酌情减少用量,且加量要缓慢。

【药物相互作用】(1)本品可增强镇痛药、催眠药、抗组胺药、麻醉药及乙醇的中枢抑制作用。(2)不宜与奎尼丁合用。

【药物过量】长期服用大剂量后,可有色视改变如蓝绿色盲或发生黄视。急性中毒者可发生震颤、嗜睡、血压降低,脉搏减慢及体位性舒张压升高。也可发生心电图 T 波变化,少数引起癫痫发作。主要采取对症治疗及支持疗法。

【贮藏】遮光,密封保存。

【规格】(1)25mg;(2)50mg

【剂型】片剂

丙氯拉嗪

【功用作用】抗精神病作用比氯丙嗪强比三氟拉嗪弱,有显著镇静作用和较强镇吐作用。

【适应症】用于急、慢性精神病、神经官能症及止吐。亦可用于美尼尔氏综合征。

【用法用量】口服:精神病;每日 50~100mg,分次服用。用于止吐:每次 5~10mg,每日 3 次。用于美尼尔氏综合征:每日 15~30mg 分次服。

【剂型规格】片剂:5mg,10mg,25mg 注射剂:5mg(1ml);栓剂:2.5mg,5mg,25mg。

三氟丙嗪

【功能主治】抗精神病作用较氯丙嗪强。1.用于治疗精神分裂症;2.用于镇吐。

【用法及用量】口服或肌注,每日 30~150mg。

【不良反应和注意】主要是锥体外系反应,其他有困倦、体位性低血压、口干、视力模糊等不良反应。

【剂型规格】片剂:10mg,25mg,50mg。注射液:10mg(1ml)。

乙酰丙嗪

【药理】药效学:抗精神病的效应系由于在脑内阻断多巴胺受体所致。此类药物还可产生 α 肾上腺素受体阻断作用,并可影响下丘脑与脑下垂体的内分泌。其镇静作用系由于抑制脑干网状结构的上行激活系统。制止呕吐系影响了延脑的呕吐中枢的活动而致。

【适应症】作用基本与氯丙嗪相似,抗精神病作用比氯丙嗪弱。用途同氯丙嗪,但疗效较差。

吩噻嗪类药适用于治疗急、慢性精神分裂症、燥狂症、反应性精神病及其他重症精神病的对症治疗,可控制兴奋、攻击、幻觉、妄想、思维联想障碍及情绪冲动、木僵等症状。不适用于伴随意识障碍而产生的精神异常。小量的氯丙嗪、奋乃静或三氟拉嗪也能制止呕吐。氯丙嗪属二甲胺族吩噻嗪类药物,镇静作用明显,可产生较强的抗胆碱作用及中度的锥体外系症状;止吐作用较强,可制止多种原因引起的呕吐;为抗精神病药的 대표药物,小剂量可作为镇吐药使用。

【用法用量】本品 20mg 与异丙嗪 50mg,哌替啶 100mg,5%葡萄糖 250ml 配成冬眠合剂,每日口服 3 次,每次 10mg;肌注每次 20mg;静滴每次 20mg(稀释至每 ml 含 0.1~0.2mg)。

【不良反应】口干,腹或胃部不适。周围神经炎,嗜睡,乏力,心悸,肥胖,闭经,乳房肿胀。可能引起过敏反应:皮疹,药热,面部潮红或苍白,气喘,胸闷。过敏性休克。有轻度局部刺激。

【贮藏】避光,密闭保存。

【剂型规格】片剂:每片 10mg;注射剂:每支 2ml:20mg

美索达嗪

【功能主治】本品为甲硫达嗪的代谢产物,抗精神病作用相似于氯丙嗪,但锥体外系反应少。【适应症】主要用于精神分裂症及神经官能症。

【用法用量】口服:精神病的治疗:每次 50mg,每日 3 次;如需要可增加剂量达每日 400mg,分次服。肌注:开始剂量 25mg,需要时 30~60 分钟重复注射,直到每日 200mg。

【剂型规格】片剂:10mg,25mg,50mg,100mg;注射剂:25mg(1ml)。

(周好田 赵淑萍 宋涛)

第二节 丁酰苯类

氟哌啶醇

【药理作用】本品属丁酰苯类抗精神病药,抗精神病作用与其阻断脑内多巴胺受体,并可促进脑内多巴胺的转化有关,有很好的抗幻觉妄想和抗兴奋躁动作用,阻断锥体外系多巴胺的作用较强,镇吐作用亦较强,但镇静,阻断-肾上腺素受体及胆碱受体作用较弱。

【药代动力学】口服吸收快,血浆蛋白结合率约 92%,生物利用度为 40%~70%,口服 3~6 小时血药浓度达峰值,半衰期为 21 小时。经肝脏代谢,单剂口服约 40%在 5 日内随尿排出,其中 1%为原形药物,活性代谢物为还原氟哌啶醇。大约 15%由胆汁排出,其余由肾排出。