



2019

国家执业药师考试

教材精讲

药学专业知识的(二)

(第二版)

总主编 宋粉云 主编 何冰

赠2套模拟试卷
100%解析

药师在线20元优惠券



手机APP刷题

精品题库



中国健康传媒集团
中国医药科技出版社



2019 国家执业药师考试教材精讲

第二版

药学专业知识（二）

总主编 宋粉云

主 编 何 冰

编 委 (按姓氏笔画排序)

刘佐仁 李晓芳 何 冰

宋粉云 张万金



中国健康传媒集团
中国医药科技出版社

内 容 提 要

本书由从事执业药师考前培训的权威专家根据最新版执业药师资格考试大纲及考试指南的内容要求精心编写而成。本书内容精练,重点突出,便于考生在有限的时间内抓住重点和考点,进行有效的复习,掌握考试的主要内容。书后附有模拟试卷,方便考生系统复习后自查备考。本书是参加2019年国家执业药师资格考试考生的首选辅导用书。

图书在版编目(CIP)数据

药专业知识·二/何冰主编. —2版. —北京:中国医药科技出版社,2019.1
2019国家执业药师考试教材精讲
ISBN 978-7-5214-0643-6

I. ①药… II. ①何… III. ①药理学-资格考试-自学参考资料 IV. ①R9

中国版本图书馆CIP数据核字(2018)第290535号

美术编辑 陈君杞

出版 中国健康传媒集团 | 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 787×1092mm¹/₁₆

印张 19

字数 454千字

初版 2018年1月第1版

版次 2019年1月第2版

印次 2019年8月第3次印刷

印刷 北京市密东印刷有限公司

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 978-7-5214-0643-6

定价 35.00元

版权所有 盗版必究

举报电话:010-62228771

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

编写说明

- ✱ 工作忙，没有大段完整的时间能静下心来看书；
- ✱ 考试指南又大又厚，携带不方便，想复习时书却总不在身边；
- ✱ 考试指南中知识太多，到底哪个才是重点，哪些才是要考的内容，茫然、着急，却总是理不出个头绪；

- ✱ 知识点太多，总是背了又忘，忘了又背，反反复复，浪费了本就少得可怜的时间，却还是找不到有效的记忆方法；

- ✱ 系统复习结束了，却不了解考试题型是什么样，自己是否能顺利答完全部试题。

类似的心路历程可能在许多考生的复习过程中都出现过。为帮助考生在有限的复习时间里抓住重点、高效复习、一次顺利通过国家执业药师资格考试，我们组织国内工作在教学一线、有着丰富考前培训经验的专家教授编写了这套《国家执业药师考试教材精讲》丛书。

本丛书特点如下。

- ✱ 尽量全面覆盖大纲要点内容，用一颗至三颗星标注考点分级，重要考点用波浪线突出；

- ✱ 用精准、简洁的文字高度压缩考试指南内容，通过对比记忆、联想记忆为考生理出清晰的记忆思路，在有限、片段的时间里记住大部分考试内容；

- ✱ 书后设有模拟试卷，便于考生自查备考，模拟考场，熟悉题型。

国家执业药师资格考试从执业药师岗位职责和实践内容出发，以培养具备在药品质量管理和药学服务方面的综合性职业能力、自主学习和终身学习的态度和意识、较好地服务公众健康素质的人才为目标。希望考生能通过本套丛书的学习领会考试精神，顺利通过考试。

为了不断提升本套考试用书的品质，欢迎广大读者提出宝贵意见，我们将在今后的工作中不断修订完善。

中国医药科技出版社
2019年1月

目 录

第一章 精神与中枢神经系统疾病用药	1
第一节 镇静与催眠药	1
第二节 抗癫痫药	3
第三节 抗抑郁药	7
第四节 脑功能改善及抗记忆障碍药	11
第五节 镇痛药	13
第二章 解热、镇痛、抗炎药及抗痛风药	17
第一节 解热、镇痛、抗炎药	17
第二节 抗痛风药	20
第三章 呼吸系统疾病用药	24
第一节 镇咳药	24
第二节 祛痰药	25
第三节 平喘药	27
第一亚类 β_2 受体激动剂	27
第二亚类 白三烯受体阻断剂	30
第三亚类 磷酸二酯酶抑制剂	31
第四亚类 M 胆碱受体阻断剂	32
第五亚类 吸入性糖皮质激素	33
第四章 消化系统疾病用药	37
第一节 抗酸剂与抑酸剂	37
第一亚类 抗酸剂	37
第二亚类 抑酸剂——组胺 H_2 受体阻断剂	38
第三亚类 抑酸剂——质子泵抑制剂 (PPI)	40
第二节 胃黏膜保护剂	42
第三节 助消化药	43
第四节 解痉药与促胃肠动力药	45



第一亚类 解痉药	45
第二亚类 促胃肠动力药	47
第五节 泻药与止泻药	49
第一亚类 泻药	49
第二亚类 止泻药	51
第三亚类 微生态制剂	53
第六节 肝胆疾病辅助用药	54
第五章 循环系统疾病用药	57
第一节 抗心力衰竭药	57
第一亚类 强心甘类正性肌力药	57
第二亚类 非强心甘类正性肌力药	59
第二节 抗心律失常药	61
第三节 抗心绞痛药	67
第一亚类 硝酸酯类药	68
第二亚类 钙通道阻滞剂 (CCB)	69
第四节 抗高血压药	72
第一亚类 血管紧张素转换酶抑制剂 (ACEI)	72
第二亚类 血管紧张素 II 受体阻断剂 (ARB)	74
第三亚类 肾素抑制剂	76
第四亚类 其他抗高血压药	77
第五节 调节血脂药	80
第一亚类 羟甲基戊二酰辅酶 A (HMG-CoA) 还原酶抑制剂	80
第二亚类 贝丁酸类药	83
第三亚类 烟酸类	84
第四亚类 胆固醇吸收抑制剂	86
第六章 血液系统疾病用药	87
第一节 促凝血药	87
第二节 抗凝血药	90
第一亚类 维生素 K 拮抗剂	90
第二亚类 肝素与低分子肝素	91
第三亚类 直接凝血酶抑制剂	93
第四亚类 凝血因子 X 抑制剂	94
第三节 溶栓药	95
第四节 抗血小板药	97
第一亚类 环氧酶抑制剂	97
第二亚类 二磷酸腺苷 (ADP) P2Y ₁₂ 受体阻断剂	99
第三亚类 磷酸二酯酶 (PDE II) 抑制剂	101

第四亚类 整合素 (II b/III a) 受体阻断剂	102
第五节 抗贫血药	102
第一亚类 铁剂	103
第二亚类 巨幼细胞贫血治疗药	104
第三亚类 重组人促红素	106
第六节 升白细胞药	106
第一亚类 兴奋骨髓造血功能药	107
第二亚类 粒细胞集落刺激因子和粒细胞-巨噬细胞集落刺激因子	108
第七章 利尿剂与泌尿系统疾病用药	109
第一节 利尿剂	109
第一亚类 袢利尿剂	109
第二亚类 噻嗪类利尿剂	111
第三亚类 留钾利尿剂	112
第四亚类 碳酸酐酶抑制剂	114
第二节 抗前列腺增生症药	115
第三节 治疗男性勃起功能障碍 (ED) 药	118
第一亚类 5 型磷酸二酯酶 (PDE5) 抑制剂	118
第二亚类 雄激素	120
第八章 内分泌系统疾病用药	122
第一节 肾上腺糖皮质激素	122
第二节 雌激素	125
第三节 孕激素	126
第四节 避孕药	128
第五节 蛋白同化激素	130
第六节 甲状腺激素及抗甲状腺药	131
第一亚类 甲状腺激素	131
第二亚类 抗甲状腺药	132
第七节 胰岛素及胰岛素类似物	134
第八节 口服降糖药	136
第一亚类 磺酰脲类促胰岛素分泌药	136
第二亚类 非磺酰脲类促胰岛素分泌药	139
第三亚类 双胍类药	140
第四亚类 α -葡萄糖苷酶抑制剂	141
第五亚类 胰岛素增敏剂	142
第六亚类 胰高血糖素样肽-1 受体激动剂	143
第七亚类 二肽基肽酶-4 (DPP-4) 抑制剂	144
第九节 调节骨代谢与形成药	145



第一亚类 钙剂和维生素 D 及其活性代谢物	146
第二亚类 双膦酸盐类	148
第三亚类 降钙素	150
第四亚类 雌激素受体调节剂	151
第九章 调节水、电解质、酸碱平衡药与营养药	153
第一节 调节水、电解质平衡药	153
第二节 调节酸碱平衡药	156
第三节 葡萄糖与果糖	157
第四节 维生素	159
第五节 氨基酸	164
第十章 抗菌药物	167
第一节 青霉素类抗菌药物	167
第二节 头孢菌素类抗菌药物	170
第三节 其他 β -内酰胺类抗菌药物	177
第四节 氨基糖苷类抗菌药物	182
第五节 大环内酯类抗菌药物	185
第六节 四环素类抗菌药物	188
第七节 林可霉素类抗菌药物	190
第八节 多肽类抗菌药物	192
第九节 酰胺醇类抗菌药物	195
第十节 氟喹诺酮类抗菌药物	196
第十一节 硝基咪唑类抗菌药物	199
第十二节 硝基咪唑类抗菌药物	200
第十三节 磺胺类抗菌药物及甲氧苄啶	202
第十四节 其他抗菌药物	204
第十五节 抗结核分枝杆菌药	207
第十六节 抗真菌药	211
第十一章 抗病毒药	218
第十二章 抗寄生虫病药	223
第一节 抗疟药	223
第二节 抗肠蠕虫药	224
第十三章 抗肿瘤药	227
第一节 直接影响 DNA 结构和功能的药物	227
第一亚类 破坏 DNA 的烷化剂	227

第二亚类 破坏 DNA 的铂类化合物	229
第三亚类 破坏 DNA 的抗生素	231
第四亚类 拓扑异构酶抑制剂	232
第二节 干扰核酸生物合成的药物 (抗代谢药)	234
第三节 干扰转录过程和阻止 RNA 合成的药物	236
第四节 抑制蛋白质合成与功能的药物 (干扰有丝分裂药)	238
第五节 调节体内激素平衡的药物	241
第六节 靶向抗肿瘤药	244
第一亚类 酪氨酸激酶抑制剂	244
第二亚类 单克隆抗体	245
第七节 放疗与化疗止吐药	247
第十四章 眼科疾病用药	249
第一节 抗眼部细菌感染药	249
第二节 降低眼压药	250
第三节 抗眼部病毒感染药	253
第四节 眼用局部麻醉药	254
第五节 散瞳药	254
第十五章 耳鼻喉科疾病用药	256
第一节 消毒防腐药	256
第二节 减鼻充血药	257
第十六章 皮肤科疾病用药	258
第一节 皮肤寄生虫感染治疗药	258
第二节 痤疮治疗药	259
第三节 皮肤真菌感染治疗药	261
第四节 外用糖皮质激素	262
模拟试卷一	264
模拟试卷二	272
模拟试卷一参考答案	280
模拟试卷二参考答案	281
模拟试卷一解析	282
模拟试卷二解析	287

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 分类★★★

1. 巴比妥类 苯巴比妥、异戊巴比妥。
2. 苯二氮草类 地西洋、氯硝西洋、氟西洋、劳拉西洋、阿普唑仑。
3. 其他类 唑吡坦、佐匹克隆。

考点2 作用特点★★★

1. 巴比妥类 作用于中枢神经的不同部位，随剂量增加，出现镇静、催眠、基础代谢率降低、麻醉、昏迷，甚至死亡。

2. 苯二氮草类 苯二氮草受体激动剂，其作用机制可能与促进中枢神经性神经递质 γ -氨基丁酸 (GABA) 的释放或突触的传递有关。剂量由小到大，作用由镇静到催眠甚至昏迷。半衰期长的苯二氮草类药物有地西洋、氟西洋等，半衰期中等或短的有氯硝西洋、劳拉西洋、阿普唑仑等。

3. 其他

(1) 佐匹克隆：作用于 GABA 受体，具有镇静催眠、抗焦虑、肌肉松弛和抗惊厥等作用。

(2) 唑吡坦：GABA_A 受体激动剂，仅具有镇静催眠作用，而无抗焦虑、肌肉松弛和抗惊厥等作用。

考点3 典型不良反应★★★

1. 巴比妥类 常见嗜睡、精神依赖性、步履蹒跚、肌无力等“宿醉”现象。依赖性、戒断综合征及剥脱性皮炎。

2. 苯二氮草类 嗜睡、依赖性、宿醉，老年、体弱、幼儿、肝病、低蛋白血症敏感，突然停药出现撤药症状。

3. 其他类

(1) 唑吡坦：常见共济失调、精神紊乱，尤以老年患者居多。

(2) 佐匹克隆：常见嗜睡、精神错乱、酒醉感、戒断现象。

考点4 禁忌证★★★

1. 巴比妥类 严重呼吸功能不全、肝硬化、血卟啉病、贫血、未被控制的糖尿病、过敏者。

2. 苯二氮草类 过敏、妊娠、新生儿禁用，呼吸抑制、肌无力、严重肝损害者禁用硝西洋、氟西洋。

3. 其他 重症肌无力、失代偿呼吸功能不全、严重睡眠呼吸暂停综合征及对佐匹克隆过敏者禁用佐匹克隆。

考点5 药物相互作用★★★

1. 巴比妥类

(1) 肝药酶诱导剂——加速自身及合用药物的代谢，与乙酰氨基酚合用肝毒性增加；



与糖皮质激素、强心苷类、环孢素、奎尼丁、三环类抗抑郁药合用降低药物的效应；与抗凝血药合用抗凝作用减弱，停药后又可引起出血倾向。

(2) 增加代谢产物的毒性，与麻醉药物氟烷、甲氧氟烷合用，增加肝、肾毒性风险，与氯胺酮合用增加血压降低及呼吸抑制的风险。

(3) 与中枢抑制药、单胺氧化酶抑制药、吩噻嗪类和四环类抗抑郁药合用加强中枢抑制作用。

(4) 与吩噻嗪类和四环类抗抑郁药合用，增加中枢神经抑制作用。

2. 苯二氮草类

(1) 与成瘾性药物合用增加成瘾危险性。

(2) 与抗高血压药或利尿药合用增强降压效果。

(3) 与西咪替丁合用减少代谢使血药浓度升高（劳拉西洋无影响）。

(4) 与卡马西平合用缩短半衰期。

(5) 与普萘洛尔合用改变发作类型和频率，注意调整剂量。

3. 其他类

(1) 唑吡坦：与氯丙嗪合用增加清除时间，与丙米嗪合用降低峰浓度。

(2) 佐匹克隆：加强中枢抑制作用，增加戒断症状的出现。

考点6 用药监护★★★

1. 依据睡眠状态选择用药

(1) 原发性失眠首选非苯二氮草类药物，难以入睡和夜间觉醒或早间觉醒过早者，可选服唑吡坦、艾司佐匹克隆，无镇静和宿醉现象。

(2) 对人睡困难者首选艾司唑仑或扎来普隆。

(3) 对焦虑型、夜间醒来次数较多或早醒者可选用氟西洋或选用三唑仑。

(4) 对由精神紧张、情绪恐惧或肌肉疼痛所致的失眠，可选氯美扎酮。

(5) 对由于自主神经功能紊乱，内分泌平衡障碍及精神神经失调所致的失眠，可选用谷维素。

(6) 对忧郁型的早醒失眠者，可配合抗抑郁药阿米替林和多塞平。

2. 注意用药的安全性

(1) 镇静催眠药长期使用易产生耐药性及依赖性，应交替使用。

(2) 服用镇静催眠药后应注意避免驾车、操纵机器和高空作业。

(3) 服用镇静催眠药期间不宜饮酒。

3. 关注巴比妥类的合理应用

(1) 注意过敏者，易出现皮疹，严重者可能发生剥脱性皮炎和史蒂文斯-约翰综合征。若过敏，出现皮疹等需停药。

(2) 使用巴比妥类药时应严格控制静脉给药剂量和选择合理给药方式，避免出现严重呼吸抑制、心律失常。

(3) 当本品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草类的敏感性和“宿醉”现象

考点7 主要药品★★★

地西洋

【适应证】用于焦虑、镇静催眠、抗癫痫和抗惊厥，并缓解炎症所引起的反射性肌肉痉

挛等；也可用于治疗惊厥症、紧张性头痛及家族性、老年性和特发性震颤，或手术麻醉前给药。

【注意事项】

- (1) 同类药交叉过敏。
- (2) 急性酒精中毒、昏迷或休克时注射地西洋可延长血浆半衰期。
- (3) 有药物滥用或依赖史、肝肾功能不全者可延长血浆半衰期；严重的精神抑郁者可使病情加重。
- (4) 可加重伴呼吸困难的重症肌无力患者和严重慢性阻塞性肺部病变患者的病情及急性或隐性闭角型青光眼发作。
- (5) 静脉注射易发生静脉血栓或静脉炎。静注速度不宜过快。
- (6) 治疗癫痫时注意其他抗癫痫药的剂量，不宜突然停药。
- (7) 一般不宜静脉滴注，除外癫痫持续状态。
- (8) 长期使用本品，停药前应渐减量。
- (9) 在妊娠初期3个月内，有增加胎儿致畸的危险，妊娠期间尽量勿用。

佐匹克隆

【适应证】用于失眠。

【注意事项】

- (1) 哺乳期妇女不宜使用。
- (2) 大量长期用药突然停药可引起戒断症状。不宜驾车、操作机械或高空作业等。
- (3) 肌无力者需进行监护，呼吸、肝肾功能不全者应调整剂量。
- (4) 连续用药时间一般不应超过4周。
- (5) 15岁以下儿童不宜应用。

唑吡坦

【适应证】用于偶发失眠和暂时失眠患者。

【注意事项】

- (1) 肝肾功能不全者血浆清除时间可延长。
- (2) 急性酒精中毒者应用时可发生致命危险。
- (3) 有酒精或药物滥用或依赖史者，对本品可能产生依赖性。
- (4) 有精神抑郁者，唑吡坦可使症状加重。
- (5) 严重慢性阻塞性肺病或有睡眠呼吸暂停综合征者，可加重疾病的症状。
- (6) 出现腹部疼痛，神经痛、不明原因疲劳无力等需即停药，并在停药48h后随访。
- (7) 老人出现步态不稳、手足笨拙等症状时，核对剂量。个体差异很大，根据治疗效果和症状，逐步调整。

第二节 抗癫痫药

考点1 分类★★★

1. 巴比妥类 苯巴比妥、异戊巴比妥钠、扑米酮。
2. 苯二氮草类 地西洋、氯硝西洋、硝西洋。
3. 乙内酰脲类 苯妥英钠。
4. 二苯并氮草类 卡马西平、奥卡西平。



5. γ -氨基丁酸类似物 加巴喷丁、氨己烯酸。

6. 脂肪酸类 丙戊酸钠。

考点2 作用特点★★★

1. 巴比妥类 苯巴比妥、异戊巴比妥钠、扑米酮。

(1) 抗癫痫作用: 增强 γ -氨基丁酸 (GABA) A 型受体活性, 抑制谷氨酸兴奋性, 降低病灶细胞膜兴奋性, 抑制病灶异常放电及向周围组织扩散。

(2) 抗惊厥作用: 调节钠、钾、钙通道及 Na^+ , K^+ -ATP 酶活性。

2. 苯二氮草类 地西洋、氯硝西洋、硝西洋。

(1) 抗癫痫作用: 间接 GABA 受体激动剂。

(2) 抗惊厥作用: 抑制皮质、丘脑和边缘系统病灶异常放电及向周围组织扩散。

3. 乙内酰脲类 苯妥英钠。膜稳定, 减少 Na^+ 内流; 吸收不完全, 血浆蛋白结合率高, 碱性尿排泄快。

4. 二苯并氮草类 卡马西平、奥卡西平。

(1) 抗癫痫作用: 抑制 Na^+ 通道, 抑制癫痫病灶及其周围神经元高频放电。

(2) 卡马西平口服吸收不规则, 为肝药酶诱导剂。

5. γ -氨基丁酸类似物 加巴喷丁、氨己烯酸。

(1) GABA 氨基转移酶抑制剂。

(2) 加巴喷丁对 GABA 受体无激动作用, 也不抑制 GABA 的再摄取, 而是增加脑组织 GABA 的释放。

(3) 氨己烯酸不可逆抑制 GABA 氨基转移酶, 减少 GABA 降解, 从而提高脑内 GABA 浓度, 抑制癫痫。

6. 脂肪酸类 丙戊酸钠。抗癫痫作用: 可能为抑制 GABA 的降解或促进其合成, 从而增加脑内 GABA 浓度, 促使 Cl^- 内流, 使胞膜的超极化稳定。

考点3 典型不良反应★★★

1. 巴比妥类及苯二氮草类 典型不良反应详见本章第一节。

2. 乙内酰脲类 (苯妥英钠)

(1) 行为改变、笨拙或步态不稳、共济失调、眼球震颤、肌力减弱、嗜睡、发音不清、手抖、齿龈增生、出血及昏迷。

(2) 不良反应与血浆药物浓度密切相关。①血浆浓度 $> 20 \mu\text{g/ml}$ 时出现眼球震颤。

②血浆浓度 $> 30 \mu\text{g/ml}$ 时出现共济失调。③血浆浓度 $> 40 \mu\text{g/ml}$ 会出现严重不良反应, 如嗜睡、昏迷。

3. 二苯并氮草类 (卡马西平)

(1) 视物模糊、复视、眼球震颤、头痛。

(2) 变态反应、史蒂文斯-约翰综合征或中毒性表皮坏死松解症, 红斑狼疮样综合征。

(3) 严重腹泻、稀释性低钠血症或水中毒 (表现为精神紊乱、持续性头痛)。

4. 脂肪酸类 (丙戊酸钠)

(1) 过敏性皮疹、血小板减少症或血小板凝聚抑制以致异常出血或瘀斑。

(2) 肝脏中毒出现球结膜和皮肤黄染、胰腺炎、月经不规律及多囊卵巢、体重增加。

考点4 禁忌证★★★

1. 巴比妥类及苯二氮草类药禁忌证见本章第一节。

2. 对乙内酰胺类药过敏者及心功能损害者禁用。
3. 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，血小板、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。
4. 对丙戊酸钠过敏者及有明显肝脏功能损害患者禁用。

考点5 药物相互作用★★★

1. 乙内酰胺类

- (1) 与糖皮质激素、含雌激素的口服避孕药、促皮质激素、环孢素、左旋多巴等合用时，苯妥英钠为肝药酶诱导剂，加速代谢，降低药物的疗效。
- (2) 与香豆素类抗凝血药、氯霉素、异烟肼等药合用，抑制肝药酶，使苯妥英钠的血浆浓度增高。与香豆素类抗凝血药合用时，可增加抗凝效应，但持续应用时则降低。
- (3) 苯巴比妥或扑米酮对苯妥英钠存在较大影响，应定期检测血浆药物浓度。
- (4) 苯妥英钠与卡马西平合用，可通过肝药酶诱导而降低卡马西平的血浆药物浓度；与大量抗精神病药或三环类抗抑郁药合用可诱发癫痫发作，调整苯妥英钠剂量。

2. 二苯并氮草类

- (1) 卡马西平与对乙酰氨基酚合用使肝毒性增加，后者疗效降低；与香豆素类抗凝血药合用，抗凝作用减弱。
- (2) 卡马西平与锂盐合用可引起严重的神经毒性。
- (3) 卡马西平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。
- (4) 奥卡西平与卡马西平、苯妥英钠合用，使后者的半衰期缩短；与丙戊酸钠合用，使半衰期延长。

3. 脂肪酸类（丙戊酸钠）

- (1) 麻醉药或中枢抑制剂与丙戊酸钠合用，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，易引起出血。与阿司匹林或双嘧达莫合用，由于减弱血小板凝聚而使出血时间延长。
- (3) 与苯巴比妥合用，增加镇静作用导致嗜睡；与扑米酮合用，可使后者的血浆药物浓度升高；与苯妥英钠或卡马西平合用，需监测血浆药物浓度并合理调整剂量。

考点6 用药监护★★★

1. 提倡有规律用药

- (1) 小剂量开始用药。
- (2) 给药次数根据半衰期确定，大多数为2~3次/日，半衰期长的苯巴比妥、苯妥英钠每天1次，睡前服。
- (3) 儿童患者使用此类药需要更频繁地调整剂量并要按体重计算给药量。

2. 换药与停药应有专业医师的指导 抗癫痫药应在神经内科医师指导下停药。除非必需，应避免突然停药，尤其是巴比妥类及苯二氮草类药。新药达稳态血药浓度约需经过该药的5个半衰期的时间，一般1~2周，从一个抗癫痫药换为另一种也应谨慎，只有当新的服药法已大致确立，才可渐减第1种药。接受几种抗癫痫药治疗时，不能同时停，停药也有癫痫复发的风险。

3. 关注特殊人群的安全性

- (1) 驾驶司机：1年无发作，3年内仅睡眠发作，撤药6月后方可驾车。



(2) 妊娠及哺乳期妇女应用抗癫痫药有致畸风险。

(3) 对接受抗癫痫药治疗的妇女,建议在妊娠前和妊娠期应补充叶酸,一日 5 mg,可降低神经管缺陷的风险。在妊娠后期 3 个月给予维生素 K,一日 10 mg,可以有效地预防任何抗癫痫药相关的新生儿出血的风险。

考点 7 主要药品★

卡马西平

【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;预防或治疗躁狂-抑郁症。

【注意事项】

(1) 冠状动脉硬化等心脏病、肝脏疾病、肾脏疾病或尿潴留者、糖尿病、青光眼、使用其他药物有血液系统不良反应史者、抗利尿激素分泌异常或有其他内分泌紊乱者慎用。

(2) 老年人可引起精神障碍、房室传导阻滞或心动过缓,也可引起再生障碍性贫血。

(3) 用药前、后及用药时应监测全血细胞计数,检查血清铁及人体白细胞抗原等位基因。

(4) 停药指征:①肝脏中毒症状或活动性肝病,有骨髓功能抑制的明显证据。②出现心血管系统不良反应或皮疹。③用作特异性疼痛综合征的止痛时,如果疼痛完全缓解,应每月试行减量或停药。

丙戊酸钠

【适应证】用于各种类型的癫痫;尚可用于双相情感障碍相关的躁狂发作。

【注意事项】

(1) 妊娠期妇女用药应权衡利弊,哺乳妇女慎用。

(2) 3 岁以下儿童使用本品易发生肝功能损害,可蓄积在发育的骨骼内。

(3) 用药前、后及用药时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) 避免合用有肝毒性的药物。

苯妥英钠

【适应证】用于治疗强直-阵挛性发作、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;可用于治疗三叉神经痛、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等;也适用于洋地黄中毒所致的室性及室上性心律失常。

【注意事项】

(1) 本品可致畸,哺乳期妇女于用药期间应停止哺乳。

(2) 嗜酒、贫血、心血管病、糖尿病、肝肾功能损害、甲状腺功能异常者慎用。

(3) 儿童应经常监测血浆药物浓度,以决定用药次数和用量。

(4) 用药期间须监测血常规、肝功能、血钙、脑电图和甲状腺功能等,静脉给药时应持续的心电图、血压监测。

(5) 老年患者应用量应偏低,检测血浆药物浓度。静脉注射时速度需减慢,2~3 min 内不超过 50 mg。最好在睡前服用。

(6) 癫痫患者应用苯妥英钠治疗后需观察 9~14 日, 当患者不能耐受或有过敏反应时, 须立即停药。

(7) 对中枢神经的影响常在长期应用且血浆浓度超过 $30 \mu\text{g/ml}$ 后发生, 偶见于低浓度时。

苯巴比妥

【适应证】用于治疗焦虑、失眠、癫痫及运动障碍。

【注意事项】

(1) 新生儿服用本品可发生低凝血酶原血症及出血, 维生素 K 对此有治疗或预防作用。

(2) 神经衰弱、甲状腺功能亢进、糖尿病、严重贫血、发热、临产及产后、轻微脑功能障碍、低血压、高血压、肾上腺功能减退、高空作业、精细和危险作业者及老年患者慎用。

(3) 静脉注射巴比妥类药, 过快时易出现呼吸抑制、暂停, 瞳孔缩小、心律失常、体温降低甚至昏迷。

第三节 抗抑郁药

考点 1 分类 ★★★

1. 三环类抗抑郁药 丙米嗪、阿米替林、氯米帕明、多塞平。
2. 四环类抗抑郁药 马普替林。
3. 选择性 5-羟色胺 (5-HT) 重摄取抑制剂 氟西汀、帕罗西汀、舍曲林、西酞普兰、艾司西酞普兰。
4. 5-HT 和去甲肾上腺素 (NE) 重摄取抑制剂 文拉法辛。
5. 单胺氧化酶 (MAO) 抑制剂 吗氯贝胺。
6. 其他 米氮平。

考点 2 作用特点 ★★★

1. 三环类抗抑郁药 阿米替林、丙米嗪、氯米帕明和多塞平。抑制突触前膜对 5-HT 及 NE 的再摄取, 使突触间隙的去甲肾上腺素和 5-HT 浓度升高, 促进突触传递功能而发挥抗抑郁作用。

2. 四环类抗抑郁药 马普替林。抑制突触前膜对 NE 的再摄取, 增强中枢去甲肾上腺素能神经的功能, 发挥抗抑郁作用。

3. 选择性 5-HT 再摄取抑制剂 氟西汀、帕罗西汀、舍曲林、西酞普兰、艾司西酞普兰。

(1) 选择性抑制 5-HT 的再摄取, 增加突触间隙 5-HT 浓度, 从而增强中枢 5-HT 能神经功能, 发挥抗抑郁作用。

(2) 与胆碱受体、组胺受体、肾上腺素受体几乎无亲和力。

(3) 疗效与三环类抗抑郁药几无差异, 安全性和耐受性较好。

4. MAO 抑制剂 吗氯贝胺。抑制 A 型单胺氧化酶, 减少 NE、5-HT 及多巴胺的降解, 增强 NE、5-HT 和多巴胺能神经功能, 而发挥抗抑郁作用。

5. 5-HT 及去甲肾上腺素再摄取抑制剂 文拉法辛、度洛西汀。抑制 5-HT 及 NE 再摄取, 增强中枢 5-HT 能及 NE 能神经功能而发挥抗抑郁作用。

6. 其他 米氮平、曲唑酮、瑞波西汀。

(1) 米氮平通过阻断中枢 NE 能和 5-HT 能神经末梢突触前 α_2 受体, 增加 NE 和 5-HT



的间接释放,增强中枢 NE 能及 5-HT 能神经的功能,并阻断 5-HT₂、5-HT₃受体以调节 5-HT 功能,从而达到抗抑郁作用。

(2) 曲唑酮为 5-HT 受体阻断剂/再摄取抑制剂,能抑制突触前膜对 5-HT 的再摄取,并拮抗 5-HT₁受体,也能拮抗中枢 α₁受体,但不影响中枢多巴胺的再摄取。

(3) 瑞波西汀为选择性去甲肾上腺素再摄取抑制剂,通过选择性抑制突触前膜对 NE 的再摄取,增强中枢 NE 能神经的功能,从而发挥抗抑郁作用。

考点 3 典型不良反应★★★

1. 三环类抗抑郁药

(1) 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。

(2) 溢乳、嗜睡、体重增加、性功能障碍等。

2. 四环类抗抑郁药常见抗胆碱能效应

3. 选择性 5-HT 再摄取抑制剂

(1) 精神运动异常、睡眠异常、癫痫发作、5-羟色胺综合征。

(2) 与曲坦类抗偏头痛药、单胺氧化酶抑制剂、苯丙胺等合用时,警惕引发 5-羟色胺综合征,应注意在停用单胺氧化酶抑制剂后 14 日才可应用。

(3) 生殖系统常见性功能减退或障碍、内分泌异常。

4. 单胺氧化酶抑制剂 吗氯贝胺。

(1) 多汗、口干、失眠、困倦、心悸等。

(2) 震颤、肝脏转移酶 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。

考点 4 禁忌证★★★

1. 对选择性 5-HT 再摄取抑制剂及其赋形剂过敏者、正在服用单胺氧化酶抑制剂者禁用选择性 5-HT 再摄取抑制剂。

2. 对阿米替林过敏、严重心脏病、高血压、肝肾功能不全、青光眼、排尿困难、尿潴留以及同时服用单胺氧化酶抑制剂患者禁用阿米替林。对氯米帕明过敏者、对苯二氮草类药物和三环抗抑郁药过敏者及同时服用单胺氧化酶抑制剂治疗者、心肌梗死急性发作期者禁用氯米帕明。严重心脏病、近期有心肌梗死发作史、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、对三环类药物过敏者禁用多塞平。

3. 对四环类抗抑郁药马普替林及其赋形剂过敏者、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、合并使用单胺氧化酶抑制剂者禁用马普替林。

4. 对吗氯贝胺过敏者、有意识障碍者、嗜铬细胞瘤患者、儿童及正在服用某些可影响单胺类药物浓度的药物的患者禁用吗氯贝胺。

5. 对文拉法辛及其赋形剂过敏者及在服单胺氧化酶抑制剂患者禁用文拉法辛。对曲唑酮及其赋形剂过敏者、严重的心脏病或心律失常者、意识障碍者禁用曲唑酮。对米氮平及其赋形剂过敏及正在服用单胺氧化酶抑制剂患者禁用米氮平。对度洛西汀过敏与正在服用单胺氧化酶抑制剂者及未经治疗的窄角型青光眼患者禁用度洛西汀。