

## 药专业知识二

### 考点一 镇静催眠药

分类	代表药物	作用特点	
巴比妥类	苯巴比妥	<ol style="list-style-type: none"> <li>起效快慢取决于脂溶性，脂溶性高（硫喷妥钠 &gt; 司可巴比妥 &gt; 异戊巴比妥 &gt; 苯巴比妥），起效快</li> <li>呼吸抑制；中毒时应使用碳酸氢钠和呋塞米促排泄</li> <li>一旦出现皮疹，应立即停药（史蒂文森 - 约翰逊综合征）</li> </ol>	
苯二氮草类	地西洋、阿普唑仑	<ol style="list-style-type: none"> <li>促进 <math>\gamma</math>-氨基丁酸的释放；无麻醉作用</li> <li>老年人对苯二氮草类的敏感性↑，更容易出现“宿醉”现象</li> <li>癫痫持续状态：首选 iv. 地西洋 10~20 mg, 20 min 后不起效，同等剂量再注射一次</li> <li>焦虑型、夜间醒来次数较多或早醒者用氟西洋；外科手术或诊断检查时诱导睡眠用咪达唑仑</li> <li>西咪替丁对劳拉西洋无影响；三唑仑短效，地西洋长效</li> </ol>	
非苯二氮草类	环吡咯酮类	佐匹克隆	<ol style="list-style-type: none"> <li>改善起始睡眠（难以入睡）和维持睡眠质量（夜间觉醒过多或早间觉醒过早）：佐匹克隆、唑吡坦</li> <li>入睡困难患者首选扎来普隆（半衰期短，引起“宿醉”现象的可能性小）</li> <li>佐匹克隆仅用于治疗失眠；唑吡坦只有镇静催眠作用，仅用于偶发性失眠和暂时性失眠</li> </ol>
	咪唑并吡啶类	唑吡坦	
	吡唑并嘧啶类	扎来普隆	
醛类	水合氯醛	<ol style="list-style-type: none"> <li>口服、直肠给药均可</li> <li>胃肠道刺激、心律失常</li> </ol>	
褪黑素受体激动剂	雷美替胺	<ol style="list-style-type: none"> <li>维持正常睡眠 - 觉醒周期生理节律</li> <li>对入睡困难型失眠比睡眠维持型失眠更有效</li> <li>依赖性较小，无戒断反应和反跳现象</li> <li>经 CYP1A2 代谢，氟伏沙明和环丙沙星升高其血药浓度</li> </ol>	

### 考点二 抗癫痫药

分类	药物	机制及特点	适应证	不良反应	注意事项
巴比妥类	苯巴比妥、扑米酮	促进氯离子内流	—	—	
苯二氮草类	地西洋、硝西洋	增强 GABA 介导的抑制作用	—	—	
乙内酰胺类	苯妥英钠	阻滞钠通道 肝药酶诱导剂	<ol style="list-style-type: none"> <li>癫痫（失神性发作无效）</li> <li>三叉神经痛</li> <li>首选：强心苷类中毒所致的室性心律失常</li> </ol>	<ol style="list-style-type: none"> <li>牙龈增生</li> <li><math>\geq 20\mu\text{g/ml}</math> 眼球震颤</li> <li>巨幼细胞贫血（亚叶酸钙解救）</li> <li>骨质疏松（补钙剂、维生素 D）</li> <li>史蒂文森 - 约翰逊综</li> </ol>	

				合征	
二苯并氮草类	卡马西平、奥卡西平	阻滞钠通道 肝药酶诱导剂	1. 癫痫 2. 躁狂症、防治躁郁症 3. 三叉神经痛（首选）、神经源性尿崩症、糖尿病  神经病变引起的疼痛	1. 视物模糊、复视、眼球震颤、头痛 2. 史蒂文森 - 约翰逊综合征（筛查 HLA-B*1502 等位基因） 3. 水中毒（稀释性低钠血症） 4. 红斑狼疮样综合征：荨麻疹、发热、骨关节痛	1. 一年内无发作 / 3 年内只在睡眠时发作者，可驾驶轿车 / 小型货车 2. 有晕厥的患者不宜驾驶 3. 撤药 6 个月后才可驾驶 4. 补充叶酸预防神经管发育畸形 5. 后期 3 个月补充维生素 K 以预防新生儿出血
脂肪酸衍生物	丙戊酸钠	增加脑内 GABA 水平 肝药酶抑制作用	1. 各类癫痫（广谱） 2. 双相情感障碍相关的躁狂发作	1. 肝毒性、体重增加、脱发 2. 碳青霉烯类使丙戊酸钠血药浓度↓	
其他	加巴喷丁	阻滞钙通道	—	—	
	拉莫三嗪	阻滞钠通道、T 型钙通道	失神性发作	—	
	托吡酯、非氨脂	影响谷氨酸受体	—	—	
	左乙拉西坦	增强 GABA 介导的抑制作用	—	不经肝药酶代谢、不抑制肝药酶、与血浆蛋白结合率低、镇静	
	唑尼沙胺	阻滞 T 型钙通道	失神性发作	—	

### 考点三 抗抑郁药分类及作用机制

类别	药物	适应证	不良反应	用药监护
选择性 5-HT 再摄取抑制剂 (SSRI)	舍曲林、西酞普兰、氟伏沙明、氟西汀、帕罗西汀			
三环类	阿米替林、丙米嗪、氯米帕明、多塞平	1. 难治性抑郁：SNRI 2. 伴有严重焦虑障碍（社交恐惧症）的抑郁症：帕罗西汀 3. 神经性贪食症（60 mg/d）、强迫症：氟西汀	1. 抗胆碱、镇静：三环类 2. 体重增加、特异性镇静（H <sub>1</sub> 受体亲和力强）米氮平 3. 血压升高：文拉法辛、吗氯贝胺 4.5-HT 综合征：抗抑郁药 + 吗氯贝胺 5. SSRI：戒断反应，突然停药→出汗 6. 氟西汀、帕罗西汀均是 CYP2D6 的抑制剂	1. 单一用药，宜个体化，从小剂量开始，逐增剂量 2. 切忌频繁换药：起效缓慢，大多数药物一般 4 ~ 6 周方显效，米氮平和文拉法辛需 1 周 3. 足量足疗程，无效可考虑换药，若换药后无效，可考虑联合用药 4. MAOI 与其他抗抑郁药换用，需间隔 2 周后氟西汀需停药 5 周才能换用 MAOI
5-HT 及 NA 再摄取抑制剂 (SNRI)	文拉法辛、度洛西汀			
单胺氧化酶抑制剂 (MAOI)	吗氯贝胺			
NA 能及 5-HT 能抗抑郁药	米氮平			

#### 考点四 改善脑功能药

分类	药物	作用机制	特点
酰胺类中枢兴奋药	吡拉西坦、茴拉西坦、奥拉西坦	修复神经细胞，改善脑缺氧和脑损伤，提高学习和记忆能力	1. 锥体外系反应、亨廷顿病禁用吡拉西坦 2. 多奈哌齐经 CYP3A4 和 CYP2D6 代谢 3. 癫痫禁用石杉碱甲；消化性溃疡禁用胆碱酯酶抑制剂 4. 银杏叶提取物禁与抗血小板药或抗凝药合用
胆碱酯酶抑制剂	多奈哌齐、利斯的明（卡巴拉汀）、石杉碱甲、加兰他敏	抑制胆碱酯酶，改善记忆和认知功能障碍	
其他类	胞磷胆碱钠	改善脑组织代谢，促进苏醒	
	艾地苯醌	激活脑线粒体呼吸活性，增加 ATP	
	银杏叶提取物	清除氧自由基，促进脑血液循环	

#### 考点五 治疗缺血性脑血管病药

药物	作用特点	适应证
倍他司汀	1. 新型组胺类药物，激动 H <sub>1</sub> 受体，改善微循环血供，但不增加微血管的通透性 2. 主要分布在肝脏	内耳眩晕症、脑动脉硬化、缺血性脑血管疾病和高血压所致体位性眩晕及耳鸣
丁苯酞	1. 我国开发的新药，恢复缺血区脑组织能量代谢，促进中枢神经功能改善和恢复 2. 禁用于对芹菜过敏的患者	轻、中度缺血性脑卒中
尼麦角林	1. 阻断 α 受体→脑血管扩张 2. 通过 CYP2D6 代谢 3. 增强 β 受体阻断剂（普萘洛尔）对心脏的抑制作用→禁合用	1. 急、慢性脑血管疾病和代谢性脑供血不足 2. 高血压、脑卒中后偏瘫患者的辅助治疗 3. 急、慢性周围血管障碍 4. 血管性痴呆、老年性耳聋、视网膜疾病

#### 考点六 镇痛药

药理作用	1. 镇静、镇痛（激动阿片受体）镇咳、欣快感、缩瞳、抑制呼吸和催吐 2. 扩张血管，引起血压下降 3. 延长产程、便秘、诱发支气管哮喘、胆绞痛、尿潴留	禁忌证	1. 肺源性心脏病 2. 颅脑损伤、分娩止痛 3. 支气管哮喘	
吗啡	哌替啶	羟考酮	曲马多	芬太尼
1. 用于心源性哮喘 2. 中毒征兆：针尖样瞳孔 3. 解救药物：纳洛酮	1. 可用于分娩止痛、急性胰腺炎止痛 2. 胆肾绞痛：首选哌替啶 + 阿托品 3. 不适用于癌性疼痛治疗	10 mg 相当于口服吗啡 20 mg	中枢性镇痛药	复合全麻中常用的药物
规避不利的应用方法	1. 皮下或肌肉注射需卧床，休克不皮下给药 2. 硬膜外与蛛网膜下隙给药，不可含防腐剂 3. 门诊患者使用对乙酰氨基酚与麻醉药的复方制剂			
镇痛药使用原则	1. 口服给药，尽可能避免创伤性给药 2. “按时”给药而不是“按需”给药 3. 按阶梯给药：①轻度疼痛首选非甾体抗炎药；②中度疼痛弱阿片类药（可待因、双氢可待因、曲马多）；③重度疼痛强阿片类药（吗啡、哌替啶、羟考酮、芬太尼等）：无封顶			

	4. 用药应个体化
--	-----------

考点七 抗帕金森病药

种类	药物	特点、用途、ADR	禁忌证	
抗胆碱能药	苯海索 (安坦)	1. 帕金森病 (年龄小于 70 岁, 震颤明显) 2. 药物引起的锥体外系反应	痴呆、青光眼、前列腺增生	
拟多巴胺药	多巴胺前体药	左旋多巴	1. 合用增加靶器官药物浓度, 减少外周不良反应, 首选用于症状明显患者 2. 不良反应: 致残性运动并发症 ①症状波动, 包括剂末现象 (疗效减退) 和“开-关”现象; ②异动症 3. 罂粟碱、维生素 B <sub>6</sub> 、高蛋白饮食降低疗效	消化性溃疡、闭角型青光眼
	外周脱羧酶抑制剂	苄丝肼、卡比多巴		
	儿茶酚胺氧位甲基转移酶 (COMT) 抑制剂	恩他卡朋	1. 单用无效, 联用复方左旋多巴→缓解剂末现象 2. 尿液呈红棕色, 与铁剂形成螯合物	—
	中枢多巴胺受体激动剂	普拉克索	—	—
	单胺氧化酶 (MAO-B) 抑制剂	司来吉兰	1. 早期、轻度帕金森病; 缓解复方左旋多巴→剂末现象 2. 食物可促进吸收, 但酪胺类食物轻度增加高血压; 避免使用哌替啶、SSRI、SNRI	消化性溃疡、严重精神病史
	促多巴胺释放剂	金刚烷胺	缓解复方左旋多巴→异动症	—

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

一、最佳选择题

- 以下镇静催眠药中, 通过激动褪黑素受体发挥作用的是  
A. 水合氯醛  
D. 佐匹克隆 B. 扎来普隆  
E. 雷美替胺 C. 唑吡坦
- 服用地西洋后病情不会加重的是  
A. 重症肌无力 B. 抑郁症 C. 高血压  
D. COPD E. 闭角型青光眼
- 静脉注射地西洋速度过快时引起的不良反应是  
A. 惊厥 B. 心跳加快 C. 血钙下降  
D. 血糖升高 E. 呼吸抑制
- 地西洋的药理作用不包括  
A. 抗焦虑 B. 镇静 C. 催眠  
D. 抗抑郁 E. 抗癫痫
- 长期服用苯巴比妥的患者因病患需服用华法林, 则其抗凝作用

- A. 显著加强 B. 稍有加强 C. 减弱  
D. 消失 E. 基本不变

## 第二节 抗癫痫药

### 一、最佳选择题

- 丙戊酸钠的严重毒性是  
A. 肝功能损害 B. 再生障碍性贫血 C. 抑制呼吸  
D. 口干、皮肤干燥 E. 低血钙
- 对所有类型的癫痫都有效的广谱抗癫痫药是  
A. 乙琥胺 B. 苯巴比妥 C. 丙戊酸钠  
D. 苯妥英钠 E. 地西泮
- 巴比妥类药物的不良反应不包括  
A. 宿醉现象 B. 药物依赖性 C. 戒断综合征  
D. 齿龈增生 E. 剥脱性皮炎
- 苯妥英钠的临床适应证不包括  
A. 三叉神经痛  
B. 癫痫强直 - 阵挛性 (大) 发作  
C. 癫痫持续状态  
D. 室性心律失常  
E. 癫痫失神 (小) 发作
- 卡马西平的作用特点不包括  
A. 预防或治疗躁郁症  
B. 对肝药酶活性有诱导作用  
C. 对三叉神经痛疗效好  
D. 治疗神经源性尿崩症  
E. 口服吸收快且完全, 可每日给药 1 次

## 第三节 抗抑郁药

### 最佳选择题

- 患者, 女, 35 岁, 服用丙米嗪数月, 该患者可能出现的不良反应不包括  
A. 口干、出汗、便秘 B. 体重增加 C. 尿潴留、排尿困难  
D. 视物模糊、眼内压升高 E. 心动过缓
- 帕罗西汀的作用机制是  
A. 选择性抑制 5-HT 的再摄取, 增加突触间隙 5-HT 浓度  
B. 抑制突触前膜对 5-HT 及去甲肾上腺素的再摄取  
C. 抑制突触前膜对去甲肾上腺素的再摄取  
D. 抑制 A 型单胺氧化酶, 减少去甲肾上腺素、5-HT 及多巴胺的降解  
E. 阻断 5-HT 受体
- 不存在首关效应的选择性 5-HT 再摄取抑制剂是  
A. 氟西汀 B. 西酞普兰 C. 帕罗西汀  
D. 舍曲林 E. 氟伏沙明
- 可用于治疗神经性贪食症的抗抑郁药是  
A. 西酞普兰 B. 帕罗西汀 C. 吗氯贝胺  
D. 文拉法辛 E. 氟西汀
- 口服吸收较慢的选择性 5-羟色胺再摄取抑制剂是

- A. 西酞普兰 B. 艾司西酞普兰 C. 舍曲林  
D. 帕罗西汀 E. 氟西汀

#### 第四节 脑功能改善及抗记忆障碍药

##### 一、最佳选择题

- 多奈哌齐的药理作用是
  - 对中枢单胺氧化酶选择性高, 使脑内 DA 降解减少
  - 对中枢胆碱酯酶选择性高, 使脑内 Ach 大量增加
  - 对外周胆碱酯酶选择性高, 使突触部位 Ach 大量增加
  - 对中枢 GABA 转氨酶选择性高, 使脑内 GABA 分解减少
  - 对外周单胺氧化酶选择性高, 使肾上腺素分解减少
- 合用可降低多奈哌齐血浆药物浓度的药物是
  - 酮康唑 B. 苯妥英钠 C. 伊曲康唑
  - 奎尼丁 E. 氟西汀
- 下列药物中, 属于酰胺类的脑功能改善及抗记忆障碍药是
  - 吡拉西坦
  - 多奈哌齐 B. 胞磷胆碱钠
  - 石杉碱甲
- 下列药物中, 应禁用于亨廷顿病的药物是
  - 吡拉西坦
  - 银杏叶提取物 B. 茴拉西坦
  - 多奈哌齐
- 可促进乙酰胆碱合成的抗记忆障碍药是
  - 多奈哌齐
  - 奥拉西坦 B. 利斯的明
  - 胞磷胆碱

#### 第五节 治疗缺血性脑血管病药

##### 最佳选择题

- 以下关于丁苯酞药代动力学特点的描述, 错误的是
  - 药物吸收后在胃、脂肪、肠、脑等组织中含量较高
  - 可迅速通过血—脑脊液屏障
  - 大部分随尿液排泄, 少部分随粪便排泄
  - 与血浆蛋白结合率 61%~65%
  - 药物在体内易蓄积
- 尼麦角林主要经过下列哪种肝药酶代谢
  - CYP1A2 B. CYP2C9 C. CYP2C19
  - CYP2D6 E. CYP3A4
- 对芹菜过敏者禁用的药物是
  - 倍他司汀 B. 丁苯酞 C. 尼麦角林
  - 普萘洛尔 E. 阿司匹林
- 因为能增强  $\beta$ 受体阻断药对心脏的抑制作用, 所以禁止与普萘洛尔合用的药物是
  - 倍他司汀 B. 丁苯酞 C. 尼麦角林
  - 二甲双胍 E. 阿司匹林
- 倍他司汀主要分布在
  - 肾脏 B. 皮肤 C. 脂肪组织

D. 肝脏 E. 胰腺

## 第六节 镇痛药

### 一、最佳选择题

1. 哌替啶的适应证不包括

- A. 手术后疼痛 B. 创伤性疼痛 C. 内脏绞痛  
D. 分娩镇痛 E. 颅脑损伤镇痛

2. 吗啡可用于治疗

- A. 分娩疼痛 B. 便秘 C. 心源性哮喘  
D. 颅内压升高 E. 前列腺肥大

3. 口服羟考酮 10 mg 相当于

- A. 肌注哌替啶 10 mg B. 口服曲马多 20 mg C. 芬太尼贴剂 10 mg  
D. 口服吗啡 20 mg E. 口服可待因 20 mg

4. 吗啡急性中毒致死的主要原因是

- A. 大脑皮层深度抑制 B. 延髓过度兴奋后功能紊乱 C. 血压过低  
D. 心跳骤停 E. 呼吸麻痹

5. 下列关于吗啡镇痛作用机制的叙述, 正确的是

- A. 抑制中枢前列腺素的合成 B. 激动中枢阿片受体 C. 抑制中枢阿片受体  
D. 抑制大脑边缘系统 E. 降低外周神经末梢对疼痛的敏感性

### 【参考答案】

#### 第一节 镇静与催眠药

1	2	3	4	5
E	C	E	D	C

#### 第二节 抗癫痫药

1	2	3	4	5
A	C	D	E	E

#### 第三节 抗抑郁药

1	2	3	4	5
E	A	B	E	C

#### 第四节 脑功能改善及抗记忆障碍药

1	2	3	4	5
B	B	A	A	D

#### 第五节 治疗缺血性脑血管病药

1	2	3	4	5
E	D	B	C	D

#### 第六节 镇痛药

1	2	3	4	5
E	C	D	E	B