

第一章 精神与中枢神经系统疾病用药

第 01 讲 精神与中枢神经系统疾病用药（一）

一、分值预测

本章预估分值：7 分

1. 其他类- γ -氨基丁酸（GABA）激动剂
2. 抗癫痫药的特点及不良反应
3. 抗抑郁药的分类及特点
4. 脑功能改善药的分类及特点
5. 治疗缺血性脑血管病药作用特点及不良反应
6. 镇痛药的适应症、不良反应和禁忌
7. 抗精神病药作用特点、适应症和不良反应

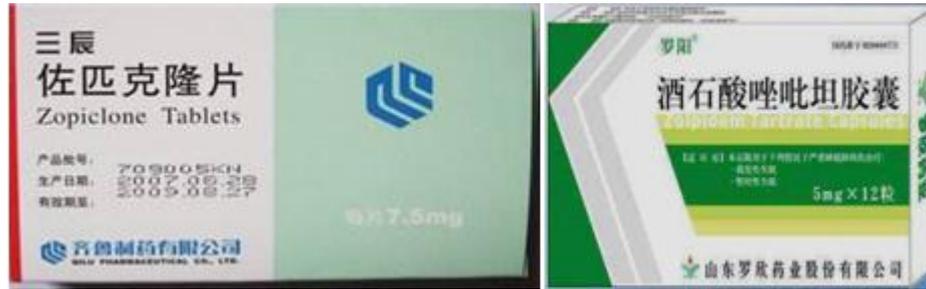
二、考点串讲

第一节 镇静与催眠药

一、药理作用与作用机制

分类	作用机制	药理作用
苯二氮草类	促进 γ -氨基丁酸（GABA）的释放或突触的传递	随着用量的加大可出现镇静到催眠甚至昏迷
巴比妥类	引起中枢神经系统非特异性抑制	剂量由小到大，相继出现镇静、催眠、基础代谢率降低、麻醉及昏迷和死亡
褪黑素类-雷美替胺	激动褪黑素受体	维持正常睡眠-觉醒周期生理节律

药物	分类	作用机制	药理作用
佐匹克隆	环吡咯酮类	激动 γ -氨基丁酸受体（GABA）更强，对失眠的特异性更高	镇静催眠，抗焦虑、肌肉松弛、抗惊厥，临床仅用于失眠
唑吡坦	咪唑并吡啶类		有镇静有催眠作用，无抗焦虑，无抗惊厥，临床仅用于镇静失眠



二、临床用药评价

(一) 作用特点

1. 苯二氮草类：

短效类：三唑仑

中效类：劳拉西泮、艾司唑仑和替马西泮

长效类：氟西泮、夸西泮

小结：长笑浮夸风，劳拉艾司（联想劳斯莱斯）替马中。

2. 其他类- γ -氨基丁酸（GABA）激动剂

药物	分类	药理作用	药动学
佐匹克隆	环吡咯酮类	镇静催眠，抗焦虑、肌肉松弛、抗惊厥 临床仅用于失眠	口服吸收迅速，血浆结合率低，重复给药无蓄积
唑吡坦	咪唑并吡啶类	有镇静有催眠作用，无抗焦虑，无抗惊厥临床仅用于失眠	口服吸收迅速，血浆结合率高，主要经肝脏代谢



3. 失眠选药

(1) 原发性失眠首选非苯二氮草类药物，为改善起始睡眠（难以入睡）和维持睡眠质量（夜间觉醒或早间觉醒过早），可选服唑吡坦、佐匹克隆。

(2) 对入睡困难者首选扎来普隆。

(3) 对焦虑、夜间醒来次数较多者或早醒者选用氟西泮。

小结

安眠药物要慎重，难睡首选扎普隆。

焦虑不安氟西洋，原发首选唑吡坦。

诱导困难睡不着，褪黑素来调一调。



第二节 抗癫痫药

分类	药物	适应症	不良反应
二苯并氮草类	卡马西平	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。	皮疹、史蒂文斯-约翰综合征或中毒性表皮坏死松解症，严重可以致死，推荐在开始使用卡马西平前进行等位基因的筛查。
乙内酰胺类	苯妥英钠	治疗大发作（强直-痉挛发作），单纯及复杂部分性发作、继发性全面发作和癫痫持续状态。三叉神经痛。抗心律失常	齿龈增生、血药浓度超过 $20 \mu\text{g/ml}$ 时出现眼球震颤，超过 $30 \mu\text{g/ml}$ 时出现共济失调，超过 $40 \mu\text{g/ml}$ 会出现严重不良反应，如嗜睡、昏迷。
γ -氨基丁酸	丙戊酸钠	广谱抗癫痫药。包括全身性强直性-阵挛发作及部分性发作；尚可用于双相情感障碍相关的躁狂发作。	肝脏中毒出现球结膜和皮肤黄染；致死性肝功能障碍；胰腺炎；月经不规则及多囊卵巢；体重增加。
钙通道阻滞	乙琥胺	乙琥胺可有效治疗失神发作，但对全面强直-阵挛性癫痫发作或局灶性癫痫发作无效	--

第三节 抗抑郁药

一、抗抑郁药分类

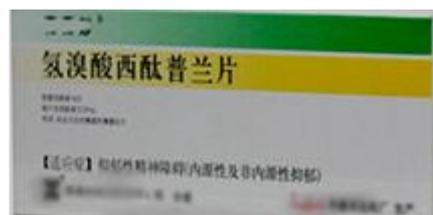
1. 三环类（抑制 5-HT 和 NA 再摄取）：阿米替林、丙咪嗪、氯米帕明、多塞平等。（三米多）

2. 5-HT 及 NA 素再摄取抑制剂：文拉法辛、度洛西汀（温度）

3. 四环类（抑制 NA 再摄取）：马普替林。（是吗）

4. 选择性 5-羟色胺再摄取抑制剂：舍曲林、氟西汀、帕罗西汀、西酞普兰。（我舍不得，艾拜佛，帕上西天）

- 5. 单胺氧化酶抑制剂：吗氯贝胺。（干嘛）
- 6. 其他类
 - (1) 5-HT 受体阻断剂/再摄取抑制剂：曲唑酮。（我去）
 - (2) 选择性 NA 再摄取抑制剂：瑞波西汀。（去瑞士）
 - (3) NA 能及特异性 5-HT 能抗抑郁药：米氮平。



二、临床用药评价

1. 选择性 5-羟色胺再摄取抑制剂：①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。②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。③出汗是突然停药或大剂量减药的最常见症状。

2. 5-HT 及 NA 再摄取抑制剂：文拉法辛、度洛西汀。

(1) 作用特点：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。

(2) 不良反应：嗜睡、性功能障碍。

第四节 脑功能改善及抗记忆障碍药

1. 酰胺类中枢兴奋药：促进乙酰胆碱合成。吡拉西坦、茴拉西坦、奥拉西坦

2. 乙酰胆碱酯酶抑制剂：抑制胆碱酯酶活性，阻止乙酰胆碱的水解，提高脑内乙酰胆碱的含量。卡巴拉汀、加兰他敏、利斯的明、石杉碱甲、多奈哌齐。

3. 其他类：

胞磷胆碱钠→促进苏醒。

艾地苯醌→改善脑内葡萄糖利用率。

银杏叶提取物→清除氧自由基。



第五节 治疗缺血性脑血管病药

(一) 作用特点

1. 倍他司汀：主要用于内耳眩晕症，亦可用于脑动脉硬化、缺血性脑血管疾病及高血压所致体位性眩晕、耳鸣。

2. 丁苯酞：主要用于治疗轻、中度急性缺血性脑卒中。

3. 尼麦角林：主要用于急、慢性脑血管疾病和代谢性脑供血不足，因扩张血管作用明显，临床也用于急、慢性周围血管障碍，如肢体血管闭塞性疾病、雷诺综合征。

二、典型不良反应和禁忌

1. 倍他司汀

偶见：出血性膀胱炎，发热，过敏反应。

对倍他司汀过敏者、嗜铬细胞瘤患者应禁用。谨慎用于有消化性溃疡史和活动期消化性溃疡者。

2. 丁苯酞

禁用于对本药过敏者和对芹菜过敏者以及对有严重出血倾向者。

• 第六节 镇痛药

吗啡

(一) 作用机制：激动中枢阿片受体，抑制某些兴奋性神经的冲动传递①三镇：镇痛、镇静、镇咳②二兴奋：兴奋呕吐中枢（恶性呕吐）；兴奋动眼神经副核（缩瞳）③一抑制：抑制呼吸。

(二) 适应证

1. 其他镇痛药无效的急性锐痛。

2. 心源性哮喘：可使肺水肿症状暂时缓解。

3. 麻醉和手术前给药可保持患者镇静进入嗜睡。

• (三) 禁忌证

1. 婴幼儿、妊娠期及哺乳期妇女、临盆产妇。

2. 颅内压增高和颅脑损伤、支气管哮喘、前列腺肥大、排尿困难。

3. 严重肝功能不全患者禁用吗啡。

