

考点1 镇静与催眠药

| 分类 | 作用机制 | 药理作用 |
|-----------|--------------------------------------|------------------------------------|
| 苯二氮䓬类 | 促进神经递质 γ -氨基丁酸(GABA)的释放或突触的传递 | 随着用量的加大, 临床表现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 |
| 醛类 | | 水合氯醛 |
| 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 |

考点2 苯二氮䓬类

| | | |
|--------------|--|----------------|
| 机制 | 促进 γ -氨基丁酸(GABA)释放 | |
| 作用特点 (分类) | 短效 | 三唑仑 三轮短 |
| | 中效 | 艾司唑仑、劳拉西泮、替马西泮 |
| | 长效 | 氟西泮、夸西泮、地西泮 |
| | 口诀: 长笑浮夸风, 劳拉艾司替马中。 | |
| 不良反应 | ①嗜睡; ②耐受性、依赖性——戒断综合征 ③“宿醉”现象(老年人比较敏感, 服用后, 可产生过度镇静、肌肉松弛作用, 觉醒后可发生震颤、思维迟缓、运动障碍、认知功能障碍、步履蹒跚、肌无力等“宿醉”现象, 极易跌倒和受伤) ④大剂量——呼吸抑制 | |

考点3 肝药酶

| | | |
|--------|---------------------------------------|----------------------------|
| 肝药酶诱导剂 | 灰黄霉素、地塞米松、苯巴比妥、苯妥英钠、卡马西平、利福平、水合氯醛和螺内酯 | 口诀: 灰黄土地诱惑大, 两本就能卡一利, 水喽! |
| 肝药酶抑制剂 | 酮康唑、氯霉素、吩噻嗪类、别嘌醇、西咪替丁、异烟肼、甲硝唑和咪康唑 | 口诀: 铜绿分别多可西, 情绪难免受抑制, 已加米! |

考点4 抗抑郁药分类

| 作用机制 | 代表药 | 口诀 |
|----------------------------|--------------------------|------------|
| 选择性5-HT(5-羟色胺)再摄取抑制剂(SSRI) | 西酞普兰、艾司西酞普兰、舍曲林、帕罗西汀、氟西汀 | 5舍不得, 怕上西天 |
| 四环类 | 马普替林 | 驷马难追 |
| 5-HT及去甲肾上腺素再摄取抑制剂 | 文拉法辛、度洛西汀 | 温度 |
| 三环类 | 阿米替林、丙米嗪、氯米帕明、多塞平 | 三米多 |
| 去甲肾上腺素能及特异性5-HT能 | 米氮平 | 没能耐 |
| 5-HT受体阻断剂/再摄取抑制剂 | 曲唑酮 | 受委屈 |
| 单胺氧化酶抑制剂 | 吗氯贝胺 | 担心吗? |



考点5 抗帕金森病药

| | |
|-------------|--|
| 拟多巴胺药 | 拟多巴胺药多巴胺前体——左旋多巴； 外周脱羧酶抑制剂——卡比多巴，苄丝肼 COMT 抑制剂——恩他卡朋 中枢多巴胺受体激动剂——溴隐亭，培高利特，普拉克索 |
| 抗胆碱药 | 苯海索 |
| 单胺氧化酶 B 抑制剂 | 司来吉兰，雷沙吉兰 |
| 其他 | 金刚烷胺，美金刚 |

考点6 抗精神病药

| | | |
|-----|-------|--|
| 第一代 | 机制 | 通过阻断脑内多巴胺 D ₂ 受体，阻断 α_1 、 α_2 肾上腺素受体，毒蕈碱 M ₁ 受体，组胺 H ₁ 受体（阻断多巴胺 D ₂ 受体 > 阻断 5-HT _{2A} 受体） |
| | 吩噻嗪类 | 奋乃静、氟奋乃静、氯丙嗪、硫利达嗪、三氟拉嗪 |
| | 硫杂蒯类 | 氯哌噻吨、三氟哌吨、氯普噻吨 |
| | 丁酰苯类 | 氟哌啶醇、五氟利多 |
| | 苯甲酰胺类 | 舒必利 |
| | 特点 | ①锥体外系反应和催乳素水平升高较明显 ②心血管系统不良反应 ③外周抗胆碱能反应 ④过度镇静和嗜睡 |
| 第二代 | 机制 | 主要阻断脑内 5-HT ₂ 受体和 D ₂ 受体 （阻断 5-HT _{2A} 受体 > 多巴胺 D ₂ 受体） |
| | 药物 | 氯氮平、奥氮平、喹硫平、利培酮、齐拉西酮、阿立哌唑 |
| | 特点 | ①较少引起锥体外系反应和催乳素水平升高 ②引起体重增加及糖脂代谢异常风险高 |

考点7 解热镇痛抗炎药

| 分类 | 代表药物 | |
|---------------|-------------------|----------------------------------|
| 非选择性 COX 抑制剂 | 水杨酸类 | 阿司匹林、贝诺酯 |
| | 乙酰苯胺类 | 对乙酰氨基酚 |
| | 芳基乙酸类 | 吲哚美辛、双氯芬酸 |
| | 芳基丙酸类 | 布洛芬、萘普生 |
| | 1, 2- 苯并噻嗪类 (昔康类) | 吡罗昔康、美洛昔康 (对 COX-2 抑制比对 COX-1 强) |
| | 吡唑酮类 | 保泰松 |
| | 非酸性类 | 尼美舒利，萘丁美酮 |
| 选择性 COX-2 抑制剂 | 塞来昔布、依托考昔、帕瑞昔布 | |



考点 8 乙酰苯胺类

| | | |
|--------|------|--|
| 对乙酰氨基酚 | 特点 | ①几乎无抗炎作用, ②对凝血无影响 |
| | 不良反应 | ①胃肠道不良反应 ②肝毒性(其中间代谢产物(N-乙酰基亚胺醌)严重肝毒性)——乙酰半胱氨酸解救 |
| | 首选 | ①解热镇痛作用缓和而持久, 抗炎抗风湿作用弱。 ②儿童感冒发热首选的解热镇痛药是对乙酰氨基酚。 ③轻中度骨性关节炎首选。 |

考点 9 选择性 COX-2 抑制剂

| | | |
|------|--|---|
| 代表药 | 塞来昔布、依托考昔、帕瑞昔布。 | |
| 特点 | 可用于消化道溃疡, 肠道溃疡, 胃肠道出血者 慎用(禁用)有心血管风险者(血管栓塞)。 | |
| 尼美舒利 | 12 岁以下禁用(肝毒性) | |
| 塞来昔布 | 分类 | COX-2 抑制剂 |
| | 不良反应 | ①长期使用塞来昔布可能增加严重心血管血栓性不良事件、心肌梗死和卒中的风险, 其风险可能是致命的 ②塞来昔布(类磺胺结构); 过敏反应 |
| | 禁忌症 | ①重度肝损伤者、有心肌梗死病史或脑卒中病史者禁用塞来昔布②对磺胺类药物过敏者禁用塞来昔布 |

考点 10 抗风湿药

| | |
|--------|---------------------------------|
| 甲氨蝶呤 | 抑制细胞内二氢叶酸还原酶。 |
| 柳氮磺吡啶 | 磺胺类药物, 属于口服不易吸收的磺胺药。 |
| 来氟米特 | 抑制合成嘧啶的二氢乳清酸脱氢酶, 使活化淋巴细胞的生长受抑制。 |
| 羟氯喹和氯喹 | 抗疟药本身有抗炎, 调节免疫作用。 |
| 金制剂 | 减少类风湿因子及其抗体形成, 抑制前列腺素合成。 |
| 双醋瑞因 | 骨关节炎 IL-1 的重要抑制剂。 |

考点 11 镇咳药

| 分类 | 代表药 | 临床应用 | 典型不良反应 |
|--------|------|---|-------------------|
| 中枢性镇咳药 | 右美沙芬 | | 常见幻想; 长期用有依赖性 |
| | 可待因 | 三镇: 适用于剧烈干咳和刺激性咳嗽(尤其适合于伴有胸痛的剧烈干咳)、中度以上疼痛、局麻或全麻时镇静 | 不宜用于痰多、痰液黏稠者。具成瘾性 |
| | 喷托维林 | | 长期产生依赖性 |
| | 苯丙哌林 | 兼具外周性和中枢性双重机制 | 一过性口腔和咽喉部麻木感 |



考点 12 祛痰药分类

| 分类 | 代表药物 | 机制 |
|----------|---------------------|---------------------------------------|
| 1. 恶心性 | 氯化铵、愈创甘油醚 | 引起恶心, 反射性引起支气管黏膜腺体分泌增加, 降低痰液黏性 |
| 2. 黏痰溶解剂 | 乙酰半胱氨酸、氨溴索、溴己新、糜蛋白酶 | 如: 乙酰半胱氨酸、氨溴索、溴己新分解痰液中的黏液成分——黏痰液化 |
| 3. 黏痰稀释剂 | 羧甲司坦 | ①分裂分子间的二硫键, 使分子变小, 降低痰液的黏度 ②促进气管分泌 |
| 4. 刺激性 | ——碘化钾、愈创木酚磺酸钾 | |

考点 13 平喘药

| |
|---|
| 1. 肾上腺素能 β_2 受体激动剂: 沙丁胺醇, 特布他林, 福莫特罗。 |
| 2. 白三烯受体阻断剂: 孟鲁司特, 普伦司特。 |
| 3. M 胆碱受体阻断剂: 异丙托溴铵、噻托溴铵。 |
| 4. 肾上腺皮质激素: 布地奈德, 氟替卡松, 倍氯米松。 |
| 5. 黄嘌呤类药物: 茶碱, 氨茶碱, 多索茶碱, 二羟丙茶碱。 |
| 6. 过敏介质阻滞剂: 色甘酸钠, 酮替芬, 曲尼司特, 西替利嗪。 |
| 7. 复方制剂: 沙美特罗氟替卡松, 布地奈德福莫特罗。 |

考点 14 β_2 受体激动剂

| | |
|---------------|--|
| 短效: 沙丁胺醇、特布他林 | 缓解轻、中度急性哮喘症状首选药 (1) 沙丁胺醇——对心脏 β_1 受体激动(增强心率)的作用弱。 (2) 特布他林——对 β_1 受体的作用(心脏兴奋), 极小。可口服。 |
| | ①不宜长期、单一使用 ②不良反应: 低钾血症、手指震颤、心悸 |
| 长效: 沙美特罗、福莫特罗 | 不单独使用, 须 + 吸入性糖皮质激素——需要长期用药者。沙美特罗特别适用于防治夜间哮喘发作。 不适合初始用于快速恶化的急性哮喘发作。但福莫特罗可作为气道痉挛的应急缓解药。 |

考点 15 M 胆碱受体阻断剂

| | |
|------|--|
| 药物 | 1. 异丙托溴铵——强效抗胆碱作用。 2. 噻托溴铵——与 M3 受体的亲和力使异丙托溴铵的 10 倍, 松弛气道平滑肌作用更强。 |
| 机制 | 阻断节后迷走神经通路, 降低迷走神经兴奋性, 松弛支气管平滑肌, 并减少痰液分泌。 |
| 不良反应 | 1. 过敏(包括皮疹、荨麻疹和血管性水肿)。 2. 口腔干燥与苦味。 3. 视物模糊、青光眼。 |
| 注意事项 | (1) 不慎污染眼睛——眼睛疼痛或不适、视物模糊、结膜充血和角膜水肿并视物有光晕或有色成像等闭角型青光眼征象——使用缩瞳药(扩展: 毛果芸香碱)。 (2) 不良反应: 口干、便秘、瞳孔散大、视物模糊、眼压升高、眼睑炎、排尿困难、心悸。 |



考点 16 抗酸剂

| 药物 | 抗酸作用 | 其他 |
|------|-------------------------------|---------------------------------|
| 碳酸氢钠 | 调节酸碱平衡 | 调节酸碱平衡。 |
| 氢氧化铝 | 抗酸, 吸附, 局部止血和保护溃疡面, 作用较强, 持久。 | 不良反应便秘 |
| 铝碳酸镁 | 快速, 持久的抗酸 | 铝离子可松弛胃平滑肌, 引起胃排空延迟和便秘——可被镁离子对抗 |

考点 17 抑酸剂

| | |
|----------------------|---------------------------------|
| 质子泵抑制剂 | 奥美拉唑、兰索拉唑 |
| H ₂ 受体拮抗剂 | 西咪替丁、法莫替丁、雷尼替丁 |
| 前列腺素类 | 米索前列醇(前列腺素 E ₁ 的类似物) |
| 钾竞争性酸阻滞剂 | 伏诺拉生 |

考点 18 组胺 H₂受体阻断剂

| | |
|------|---|
| 代表 | 西咪替丁、雷尼替丁、法莫替丁 |
| 机制 | 竞争性阻断 H ₂ 受体, 抑制基础胃酸分泌及组胺和食物刺激后引起胃酸分泌 |
| 适用 | 睡前服用, 抑制“酸突破现象” |
| 不良反应 | ①可透过血-脑屏障——精神异常、行为异常、幻觉、激动、失眠等 ②轻度抗雄性激素作用——特别是西咪替丁, 长期用药可出现男性乳房肿胀、胀痛以及女性溢乳等 雷尼/法莫替丁——对性激素影响较轻 |
| 相互作用 | 西咪替丁: 肝药酶抑制剂 雷尼替丁, 法莫替丁不属于肝药酶抑制剂。 |

考点 19 质子泵抑制剂

| | |
|------|---|
| 代表 | 奥美拉唑、兰索拉唑、泮托拉唑、雷贝拉唑 |
| 适应 | PPI 为前药, PPI 特异性地抑制 H ⁺ , K ⁺ -ATP 酶(质子泵)的活性, 抑制胃酸生成的终末环节。抑酸作用强大 |
| 作用特点 | PPI 对质子泵抑制——不可逆——单次抑酸时间 > 12h 碱性药物→胃酸破坏, 口服肠溶剂型 普通肠溶剂型不能咬碎或掰开; 特殊剂型口腔含化或用水溶解吞服, 不嚼服 |

考点 20 根除幽门螺杆菌感染的方案

| 四联疗法, 根除率较高 | | |
|--|--------------------------|---|
| PPI+ 克拉霉素 + 阿莫西林 + 铋剂 7-14d | 埃索美拉唑 20mg bid 餐前 30min | 无青霉素过敏史, 且用药前应做皮试; 克拉霉素避免与他汀类同服, 分餐制, 避免再感染 |
| | 枸橼酸铋钾 220mg bid 餐前 30min | |
| | 阿莫西林 1.0g bid 餐后 30min | |
| | 克拉霉素 500mg bid 餐后 30min | |
| | 甲硝唑 0.4g bid 餐后 30min | |
| 三联疗法, 上述方案去除铋剂——适用于肾功能减退、不耐受铋剂者, 但 H _p 根除率下降。 | | |



考点 21 保肝药

| | |
|---------|---------------------------------------|
| 促代谢及维生素 | 门冬氨酸钾镁 |
| 抗炎 | ××甘草(甘草甜素、异甘草酸镁) 复方甘草酸苷可加重低钾血症和高血压 |
| 降酶药 | 双环醇、联苯双酯 煤婆 |
| 解毒药 | 硫普罗宁、葡醛内酯、谷胱甘肽 |
| 调节磷脂药 | 多烯磷脂酰胆碱(以肝细胞膜损害为主) |
| 利胆药 | 熊去氧胆酸、腺苷蛋氨酸 |

考点 22 胆疾病用药

| | |
|---------|--------------------------------------|
| 胆疾病用药 | 作用机制特点 |
| 固醇性胆囊结石 | 鹅去氧胆酸、熊去氧胆酸、去氢胆酸:使结石中的胆固醇溶解、脱落 |
| 胆汁淤积性肝病 | 熊去氧胆酸:竞争性地抑制毒性内源性胆酸在回肠的吸收,达到抗胆汁淤积的作用 |

考点 23 泻药分类

| | |
|-------|--------------------|
| 容积性 | 欧车前,聚卡波非钙 |
| 渗透性 | 乳果糖,硫酸镁,聚乙二醇 4000 |
| 刺激性 | 酚酞,比沙可啶,番泻叶,蓖麻油 |
| 润滑性 | 甘油栓剂开塞露 |
| 促动力药 | 伊托必利,莫沙必利 |
| 促分泌药 | 鲁比前列酮,刺激肠液分泌,促进排便。 |
| 微生态制剂 | 益生菌,益生元,合生元 |

考点 24 抗心律失常药

| | | | |
|--------|-------------------------------|------------|------|
| 钠通道阻滞剂 | I A 类 | 奎尼丁,普鲁卡因胺 | 卡丁车 |
| | I B 类 | 利多卡因、苯妥英钠、 | 一本万利 |
| | I C 类 | 普罗帕酮 | C 罗 |
| II 类 | 普萘洛尔、艾司洛尔(β受体阻断剂) | | |
| III 类 | 胺碘酮、溴苄胺、索他洛尔(阻断钾通道,延长动作电位时程药) | | |
| IV 类 | 维拉帕米、地尔硫卓(维吾尔族) | | |

考点 25 胺碘酮

| | |
|------|---|
| 机制 | 通过阻断钾通道而延长心脏动作电位时程,从而加心肌组织的不应期,作用机制是阻止心肌细胞的 Na ⁺ , K ⁺ Ca ⁺ 通道,用于治疗室上性和室性心律失常。 |
| 适应症 | 广谱抗心律失常药(室性、室上性) |
| 不良反应 | ①心动过缓;②肝毒性;③肺毒性;④胃肠道不适;⑤光敏感性;⑥甲状腺功能障碍;⑦角膜色素沉着;⑧多发性神经病变 |



考点 26 血管紧张素转换酶抑制剂 (ACEI)

| | |
|------|---|
| 代表药 | 卡托普利、依那普利、贝那普利、赖诺普利、雷米普利等。 |
| 机制 | ①抑制血管紧张素转换酶的活性,抑制血管紧张素 I 转换成血管紧张素 II (Ang II); ②同时作用于缓激肽系统,抑制缓激肽降解。 扩张血管,降低血压,减轻心脏后负荷,保护靶器官功能。 是唯一具有干预 RAAS 和激肽释放酶激肽系统的双系统保护药。 |
| 不良反应 | ①常见——长期干咳;血管神经性水肿(缓激肽增多) ②高血钾; ③首剂低血压反应; ④其他——胸痛、上呼吸道症状(鼻炎);血肌酐和尿素氮及蛋白尿高;味觉障碍(有金属味)。 |

考点 27 钙通道阻滞剂

| | | | |
|------|---|-----------|------------------------------------|
| I 类 | 选择作用于 L 型钙通道的药物 | | |
| | 二氢吡啶类 | 特点 | 主要作用于动脉血管,用于降压 |
| | | 药物 | 硝苯地平、拉西地平(**地平) |
| | 非二氢吡啶类 | 特点 | 主要作用于心脏,具有负性频率、负性传导、负性肌力作用,用于抗心律失常 |
| 药物 | | 地尔硫草和维拉帕米 | |
| 作用特点 | 1. 阻滞细胞膜钙通道,抑制平滑肌 Ca ²⁺ 进入血管平滑肌细胞内——松弛血管平滑肌——改善心肌供血; 2. 降低心肌收缩力——降低心肌氧耗。 | | |
| 适应症 | A. 变异型心绞痛——最有效。其他心绞痛——也有效。 B. 伴哮喘和阻塞性肺疾病者——扩张支气管平滑肌。 C. 高血压。 D. 外周血管痉挛性疾病——雷诺综合征等。 | | |
| 不良反应 | A. 心脏抑制——心脏停搏、心动过缓、房室传导阻滞和心衰; B. 过度扩血管——低血压、面部潮红、头痛、下肢及踝部水肿; C. 反射性交感神经兴奋——心功能不全。 D. 牙龈增生。 | | |

考点 28 β 受体阻断剂

| | |
|------|---|
| 药理作用 | (1) 主要用于室上性和室性心律失常。 ①窦性心动过速:尤其伴焦虑者,心肌梗死后、心功能不全、甲亢和 β 受体功能亢进状态者。 ②室上性快速性心律失常。 ③心房扑动和心房颤动 ④促使心房颤动转复为窦性心律和维持窦性心律。 ⑤交感神经兴奋相关的室性心律失常,包括运动诱发、心肌梗死、围术期和心力衰竭相关的心律失常。 |
| 临床应用 | ①心律失常 ②高血压 ③心绞痛 ④治疗慢性心功能不全的药物 ⑤治疗甲亢 |
| 地位 | 唯一能降低心脏性猝死而降低总死亡率。 |



| | |
|--|--|
| 非选择性 β 受体阻断剂 | 普萘洛尔: 阻断 β_1 和 β_2 受体。 |
| 选择性 β_1 受体阻断剂 | 比索洛尔、美托洛尔和阿替洛尔——适于肺部疾病或外周循环受损的患者 |
| 有周围血管舒张功能的 β 受体阻断剂, 兼有阻断 α_1 受体, 产生周围血管舒张作用 | 维地洛(慢性心衰一线药)、拉贝洛尔 |
| 不良反应 | 1. 心率过慢 2. 收缩支气管, 诱发哮喘(普萘洛尔、卡维地洛支气管哮喘禁用) 3. 雷诺征样——四肢冰冷 4. 反跳现象(撤药综合征)——长期使用突然停药, 可导致血压反跳性升高, 伴头痛、焦虑。 处理: 逐渐递减, 至少经过 3 日, 一般为 2 周 |
| 禁忌 | 二、三度房室传导阻滞、病态窦房结综合征患者禁用 |

| 常用 β 受体阻断剂 | | |
|--------------------|------------------|----|
| 非选择性 | 普萘洛尔 | 脂 |
| 选择性 β_1 | 阿替洛尔 | 水 |
| | 比索洛尔 | 水脂 |
| | 美托洛尔 | 脂 |
| $\alpha_1 + \beta$ | 阿罗 --、拉贝 --、卡维地洛 | 脂 |

考点 29 调节血脂药

| 分类 | 代表药 | 药理作用 |
|--------|------------------------------------|--------------------------------------|
| 主降胆固醇 | 羟甲基戊二酰辅酶 A 还原酶抑制剂 (HMG-CoA 还原酶抑制剂) | 他汀类 降胆固醇和三酰甘油水平 |
| | 胆固醇吸收抑制剂 | 依折麦布 降低胆固醇 |
| | 抗氧化剂 | 普罗布考 降低胆固醇 |
| 主降三酰甘油 | 胆汁酸结合树脂 | 考来烯胺 ①降低胆固醇 ②对三酰甘油无影响或轻度升高 |
| | 贝丁酸类(加速脂蛋白分解, 减少脂蛋白合成) | 非诺贝特 使胆固醇和三酰甘油水平降低 |
| | 烟酸类 | 阿昔莫司 使胆固醇和三酰甘油水平降低(有利于 HDL 胆固醇增高) |

| | | | | | | | |
|-----|-----|-----|------|-----|----------|------|-----|
| | 洛 - | 辛 - | 阿托 - | 匹 - | 氟 - | 瑞舒 - | 普 - |
| 肝药酶 | 3A4 | | 2C9 | | 2C9/2C19 | | 无 |

| 他汀类药物动力学 | | | |
|----------|------------|--------|---------------|
| 内酯环型 | 脂溶性 | 辛、洛 | 洛阳信纸贵(洛、辛、脂) |
| 开环羧基型 | 水溶性 | 普, 瑞舒 | 普通瑞士人舒服喝水 |
| | 兼具有脂溶性和水溶性 | 氟、匹、阿托 | 阿托匹, 佛祖, 脂水兼容 |

| | |
|-----------|--|
| 不良反应 | 肌毒性——肌痛、肌病、横纹肌溶解症; 肝毒性——肝脏转氨酶 AST 及 ALT 升高。 胰腺炎、史蒂文斯 - 约翰综合征、多形性红斑、大疱型表皮坏死松解症。 口诀——他常吃鸡肝, 最后得了高脂血症! |
| 监测血脂和安全指标 | 肌: 肌磷酸激酶 (CK) 大于正常值 10 倍以上; 肝: (AST 及 ALT) 大于正常值 3 倍以上停药。 |



考点 30 抗心力衰竭药分类

| | |
|-------------------------------------|-------------------------|
| 1、强心苷类：地高辛 | 减轻症状和改善心功能 |
| 2、利尿剂：氢氯噻嗪 | 控制心衰患者的液体潴留 |
| 3、醛固酮受体阻断剂：螺内酯 | 与其他药物合用防止低钾 |
| 4、 β 受体阻断剂：普萘洛尔 | 抑制心肌重构，改善左室功能，降低死亡率 |
| 5、血管紧张素转换酶抑制剂（ACEI）：卡托普利 | 显著降低心衰患者死亡率 |
| 6、血管紧张素 II 受体阻断剂（ARB），与 ACEI 相近：氯沙坦 | 用于因严重咳嗽而不能耐受 ACEI 者 |
| 7、血管紧张素受体脑啡肽酶抑制剂 ARNI | 减轻症状和改善心功能 |
| 8、钠 - 葡萄糖协同转运蛋白 2 抑制剂 | 达格列净 |
| 9、伊伐布雷定 | 已使用上述药物，心率仍大于 70 次 / 分钟 |

考点 31 伊伐布雷定

| | |
|------|--|
| 机制 | 特异性抑制窦房结——降低心率 |
| 适用 | ①窦性心律且心率 ≥ 75 次 / 分 ②用于禁忌或不能耐受 β 受体阻断剂治疗时 ③可联合 β 受体阻断剂使用 |
| 应用注意 | ①心率持续 < 50 次 / 分，或心动过缓持续存在——必须停药 ②本品含乳糖，患有罕见的遗传性半乳糖不耐受症、原发性肠乳糖酶缺乏或葡萄糖 - 乳糖吸收不良的患者不应使用本品。 ③西柚汁：本品与西柚汁同服会导致伊伐布雷定的暴露量增加 2 倍。因此，应避免西柚汁的摄入。 ④常见不良反应为闪光现象（光幻视）和心动过缓，为剂量依赖性的。严重的不良反应为心房颤动、传导阻滞 |

考点 32 沙库巴曲缬沙坦

| | |
|------|---|
| 机制 | 沙库巴曲——脑啡肽酶抑制剂 缬沙坦——血管紧张素 II 受体阻断剂 |
| 适应症 | 用于射血分数降低的慢性心力衰竭（NYHA II - IV 级，LVEF $\leq 40\%$ ） |
| 用法用量 | 如果从 ACEI 转换成沙库巴曲缬沙坦，应停用 ACEI 36 小时后再换用 ARNI |
| 不良反应 | 常见不良反应：低血压、高钾血症、咳嗽、头晕 严重的不良反应：血管性水肿 |
| 禁忌 | ①禁止与 ACEI 合用 ②血钾水平 > 5.4 mmol/L 的患者不可使用 ③禁用于中期和晚期妊娠妇女 |

考点 33 低分子肝素

| | |
|------|--|
| 代表药 | 我国上市的原研产品有 4 个：达肝素钠，依诺肝素钠，钠屈肝素钙，贝米肝素钠。 |
| 临床应用 | 多数有 4 个适应症： ①外科手术，存在中度或高度风险形成血栓的患者，预防静脉栓塞。 ②已经形成血栓。 ③联合阿司匹林，用于不稳定心绞痛的治疗。 ④血液透析中预防体外循环中血凝块形成。 |
| 应用注意 | 低肝素所致的出血——救治：鱼精蛋白能部分中和，不如普通肝素效果好。 |



考点 34 直接口服抗凝药达比加群酯

| | |
|------|---|
| 作用机制 | 竞争性, 可凝血直接凝血酶抑制剂。 |
| 解救药 | 依达赛珠单抗 (Idarucizumab) 已经面世, 它是一种人源化单克隆抗体片段 (Fab) 药物, 能够与达比加群酯以 1:1 的摩尔比高度结合, 能拮抗达比加群酯的抗凝作用, 但该药还未在我国上市。 |
| 合用 | 达比加群酯是外转运体 P-gp 的底物, 与强效 P-gp 抑制剂 (胺碘酮, 维拉帕米, 奎尼丁, 克拉霉素) 和联合使用会导致达比加群酯血药浓度升高, 禁止合用环孢菌素, 伊曲康唑, 他克莫司合用。 |

考点 35 抗血小板药

| 类型 | 代表药 |
|---|------------------|
| 1. 血栓素 A ₂ 抑制剂 | 阿司匹林 |
| 2. 二磷酸腺苷 P ₂ Y ₁₂ 受体阻断剂 | 噻氯匹定、XX 格雷、X 格雷洛 |
| 3. 磷酸二酯酶抑制剂 | 双嘧达莫、西洛他唑 (双喜临门) |
| 4. 血小板膜糖蛋白 II b/ III a) 受体阻断剂 | 替罗非班、依替巴肽 |

考点 36 血小板膜糖蛋白 II b/ III a) 受体阻断剂

| GPIIb/IIIa 拮抗剂: 抑制血小板聚集, 目前最强。 | |
|--------------------------------|------|
| 1. 单克隆抗体 | 阿西单抗 |
| 2. 肽类抑制剂 | 依替巴肽 |
| 3. 非肽类抑制剂 | 替罗非班 |

· 10 ·

考点 37 溶栓药

| | |
|------|--|
| 链激酶 | 作用无选择性, 出血风险较高。因抗原性较高, 输注后可产生抗体, 在 5 天到 1 年内重复给药, 疗效可能降低, 因此, 一年内不宜重复给药。 |
| 阿替普酶 | 阿替普酶半衰期短 (4-5min), 须连续静脉给药 |
| 瑞替普酶 | 瑞替普酶半衰期长, 给药方便, 可间隔 30min 静脉注射 2 次, 治疗时间窗宽, 溶栓效果好且安全 |
| 替奈普酶 | 美国 ST 段抬高型心肌梗死的标准溶栓治疗药物, 由于单次注射方便, 不良反应少, 非常适合心肌梗死入院前在救护车上给药。 |

| 溶栓药 | 临床用药评价 | 注意事项 |
|--------------|---|---|
| 1. 阿替普酶、瑞替普酶 | 静脉溶栓首选。选择性激活血栓部位的纤溶酶原, 故不产生链激酶常见的出血并发症。 | 监护溶栓药的治疗时间窗——尽早用药: 急性脑卒中发作后, 3 ~ 4h 后仍不改善, 可能出现代谢衰竭。超过 6h 的缺血性脑卒中者可给予尿激酶。 |

考点 38 促凝血药

| | | |
|------------|--------------------------|--|
| 1. 维生素 K 类 | 维生素 K ₁ 、甲萘氢醌 | 促进凝血因子 2、7、9、10 合成。用于维生素 K ₁ 缺乏引起的出血。 |
| 2. 凝血因子 | 人凝血酶原复合物等 | |



| | | |
|------------|-----------------------|------------------------------|
| 3. 抗纤维蛋白溶解 | 氨甲苯酸、氨甲环酸 口诀: 俺甲亢 | 对纤溶酶活性增高所致的出血疗效好, 对慢性渗血效果显著。 |
| 4. 促血小板生成药 | 重组人血小板生成素, 艾曲泊帕乙醇胺 | |
| 5. 蛇毒血凝酶 | | |
| 6. 毛细血管止血药 | 卡洛磺钠, 酚磺乙胺 | 口诀: 黄毛 |

考点 39 治疗前列腺增生药

| | 代表药 | 机制 |
|----------------------|----------------|--|
| (1) $\alpha 1$ 受体阻断剂 | X 唑嗪; 坦洛新、西洛多辛 | 松弛前列腺平滑肌, 减轻膀胱出口压力——减少动力因素。 适用于: 需要尽快解决急性症状者。 |
| (2) 5α 还原酶抑制剂 | 非那 / 依立 / 度他雄胺 | 干扰睾酮对前列腺的刺激, 减少膀胱出口梗阻——减少静力因素。 |

考点 40 $\alpha 1$ 受体阻断剂阻断剂

| 分类 | 代表药 | 特点 |
|-----|---------------------|---|
| 第一代 | 酚苄明 | 非选择性 $\alpha 1$ 受体阻断剂: 可引起心动过速。 |
| 第二代 | 哌唑嗪、特拉唑嗪、多沙唑嗪和阿夫唑嗪。 | 选择性 $\alpha 1$ 受体阻断剂 容易发生直立性低血压, 眩晕。 |
| 第三代 | 坦洛新 (坦索罗辛) 和赛洛多辛。 | 高选择性 $\alpha 1$ 受体阻断剂——更好的对前列腺 $\alpha 1$ 受体的选择性。不容易发生体位性低血压。 |

考点 41 5α 还原酶抑制剂

| | |
|--------|--|
| 代表药 | ①非那雄胺、依立雄胺 (II 型 5α 还原酶抑制剂) ②度他雄胺 (I 型和 II 型 5α 还原酶的双重抑制剂) |
| 机制 | 制 5α 还原酶, 进而抑制双氢睾酮 (DHT) 产生——前列腺上皮细胞萎缩——缩小前列腺体积, 缓解 BPH 临床症状。 |
| 典型不良反应 | (1) 5α 还原酶抑制剂——性欲减退、阳痿、射精障碍、射精量减少。 (2) 无心血管不良反应, 但易引起性功能障碍。 (3) 非那雄胺——促进头发生长——用于雄性激素源性脱发。 |

考点 42 糖皮质激素

| | |
|------|---|
| 分类 | 短效: 可的松、氢化可的松; 中效: 泼尼松、泼尼松龙、甲泼尼龙、曲安西龙; 长效: 地塞米松、倍他米松 |
| 临床应用 | 替代疗法; 严重感染; 自身免疫性疾病; 过敏性疾病; 缓解急性炎症的各种症状; 休克; 血液系统疾病等。 |
| 使用方法 | (1) 小剂量代替疗法——原发 / 继发性慢性肾上腺皮质功能不全。 (2) 一般剂量长期疗法——结缔组织病、肾病综合征、顽固性支气管哮喘、中心视网膜炎、恶性淋巴瘤、淋巴细胞性白血病。 (3) 大剂量冲击疗法——严重中毒性感染及休克, 时间不超过 3 日。 |



| | |
|------|--|
| 不良反应 | A. 库欣综合征——肾上腺皮质功能亢进综合征：满月脸、向心性肥胖、紫纹、皮肤变薄、痤疮； B. 诱发三高 C. 诱发溃疡 D. 诱发感染 E. 诱发青光眼 F. 诱发骨质疏松、肌肉萎缩、伤口愈合延迟 G. 诱发或加重精神疾病（精神病或癫痫病） |
| 禁忌证 | 1. 严重精神病或癫痫病史者、活动性消化性溃疡病、骨折患者、创伤恢复期患者、角膜溃疡者、肾上腺皮质功能亢进者、严重高血压、糖尿病患者； 2. 抗菌药不能控制的感染：水痘、真菌、结核、细菌、病毒。 |

考点 43 胰岛素分类

| 分类 | 药物 | 给药时间 | 特点 |
|----------|---------|------------------------------|---|
| 短效 | 人胰岛素注射液 | 皮下：餐前 30min 静脉：抢救酮症酸中毒和昏迷 | 外观为无色透明溶液，可在病情紧急情况下静脉输注，又称为“普通胰岛素”“常规胰岛素”“中性胰岛素” |
| 分类 | 药物 | 给药时间 | 特点 |
| 速效胰岛素类似物 | 门冬胰岛素 | 皮下：餐前 5-10min 或餐后立即给药 | 起效迅速，持续时间短，能更加有效地控制餐后血糖。用药时间较短效胰岛素灵活，即便是临近餐前或餐后立刻给药也可以迅速达到有效的降血糖效果。 |
| | 赖脯胰岛素 | 皮下：餐前 0-15min 或餐后立即给药 | |
| | 谷赖胰岛素 | | |

| 分类 | 药物 | 给药时间 | 特点 |
|----------|---------|--|---|
| 中效 | 精蛋白人胰岛素 | 皮下，每日固定时间给药 | 在人胰岛素基础上添加鱼精蛋白及锌离子，接近人的体液 pH 值，溶解度降低，释放更加缓慢，使胰岛素作用持续时间延长。 |
| 长效 | 长效胰岛素 | 皮下，每日 1 次早餐前 30-60 分钟给药，部分患者需晚餐前再注射一次。 | |
| 长效胰岛素类似物 | 甘精胰岛素 | 皮下，每日固定时间给药 | 利用重组 DNA 技术，延长治疗时效。德谷胰岛素半衰期 25h，作用时间为 42h。甘精胰岛素 U300 半衰期为 19h，作用时间为 36h，比甘精胰岛素 U100 作用持续更长。这类长效胰岛素类似物降低血糖的时效性长，适于作为基础胰岛素，维持基础血糖的稳定。 |
| | 地特胰岛素 | | |
| | 德谷胰岛素 | | |

| | |
|--------|--|
| 药物相互作用 | β 受体阻断剂可降低血糖，要注意调整（减少）剂量，否则易引起低血糖。 |
| 注意事项 | 尚未开瓶使用胰岛素应在 2℃~8℃处保存。已开始使用的可在室温（最高 25℃）保存最长 4~6 周。冷冻后的胰岛素不可使用。 |
| 不良反应 | 1、低血糖反应、2、过敏反应、3、局部反应、4、皮下脂肪萎缩、5、胰岛素抵抗 |

考点 44 口服降糖药

| | |
|-----------------|---------------|
| 1. 磺酰脲类促胰岛素分泌药 | 格列 XX |
| 2. 非磺酰脲类促胰岛素分泌药 | X 格列奈（非常无奈） |
| 3. 双胍类药 | XX 双胍 一线，尤其肥胖 |



| | |
|------------------------|----------------|
| 4. α 葡萄糖苷酶抑制剂 | X 波糖、米格列醇 |
| 5. 噻唑烷二酮类胰岛素增敏剂 | X 格列酮 |
| 6. 钠 - 葡萄糖协同转运蛋白 2 抑制剂 | 达格列净, 恩格列净, |
| 7. 二肽基肽酶 -4 抑制剂 | X 格列汀 (二太太正厅级) |

考点 45 抗生素药动学分类

| | |
|---------------|--|
| 浓度依赖型 | 氨基糖苷、硝基咪唑、氟喹诺酮、多黏菌素、达托霉素 |
| 口诀 | 小米做成粘糖苷, 大坨沙星靠浓度 |
| 特点 | 该类药物对致病菌的杀菌效应和临床疗效取决于血浆峰浓度 (C_{max}), 而与作用时间和细菌接触的时间关系不密切。一般推荐日剂量单次给药方案。 |
| 时间依赖型且 PAE 较短 | β - 内酰胺类、林可霉素、部分大环内酯类 |
| 口诀 | 林青霞短时间就变红了 |
| 特点 | 当血药浓度高于致病菌 MIC 的 4 ~ 5 倍以上时, 其杀菌效能几乎达到饱和状态, 继续增加血药浓度, 其杀菌效应不再增加。一般推荐日剂量分多次给药和 (或) 延长滴注时间的给药方案。 |
| 时间依赖型且 PAE 较长 | 四环素类、替加环素、阿奇 + 克拉、糖肽类、利奈唑胺 |
| 口诀 | 阿奇替利奈吃了四颗辣糖。 |
| 特点 | 该类药物虽然为时间依赖型, 但由于 PAE 或 $t_{1/2}$ 较长, 使其抗菌作用持续时间延长。 |

抗生素药动学参数

| 分类 | 参数 |
|----------------|--|
| 浓度依赖性 | C_{max}/MIC 或 AUC_{0-24}/MIC (血浆药物峰浓度与最低抑菌浓度比值) |
| 时间依赖性 | $\%T > MIC$ (血浆药物浓度高于最低抑菌浓度的维持时间) |
| 时间依赖性且抗菌作用时间较长 | AUC_{0-24}/MIC (24h 内稳态血药浓度时间曲线下的面积与最低抑菌浓度比值) |

考点 46 抗菌药物机制

| | |
|---|-------------------------------|
| 青霉素、头孢菌素、万古霉素, 杆菌肽, 磷霉素 | 细胞壁 (青头万古杆菌磷) |
| 四环素 氨基糖苷类 (链、庆大、妥布、阿米卡星) 大环内酯类 (红霉素) 氯霉素 利奈唑胺 | 蛋白质 30 而立四环素, 红绿林利 50 载 |
| 喹诺酮类 (DNA) 利福平 (RNA) | 核酸 |
| 磺胺类 (合成酶) 甲氧苄啶 (还原酶) | 叶酸 |
| 多粘菌素、两性霉素 | 细胞膜 |



考点 47 四代头孢类药物

| | | |
|-----|-----------------------|--------|
| 第一代 | ~ 拉定, 唑啉, 氨苄, 羟氨苄, 噻吩 | 坐着拉大便 |
| 第二代 | 克洛, 吠辛, 孟多 | 多梦—克夫 |
| 第三代 | 噻肟, 曲松, 他啶, 派酮, 克肟 | 他派我去出差 |
| 第四代 | 吡肟, 匹罗 | 披露他比我强 |

| | | | | |
|-----|-----------|-----------------|-----------------|-----|
| | G+ 菌 | G- 菌 | 对 β -内酰胺酶 | 肾毒性 |
| 第一代 | 强 | 弱 | 不稳定 | 大 |
| 第二代 | 不如第一代 | 增强 | 较稳定 | 较小 |
| 第三代 | 弱 | 强, 铜绿假单胞菌有效(部分) | 高度稳定 | 基本无 |
| 第四代 | 广谱(完美), 强 | | 稳定 | 无 |

考点 48 其他 β -内酰胺类抗菌药物

| | 代表药 | 特点 | 口诀 |
|---------------------|----------------------------|-------------------------------------|---------------|
| 1. 单环 β -内酰胺类 | 氨曲南 | 氨基糖苷类的替代品。 窄, 仅 G- 菌——铜绿假单胞菌等杆菌。 | 口诀: 单曲循环 |
| 2. 头霉素类 | 头孢-西丁、美唑、米诺 \approx 二代头孢 | 对大多数超广谱 β -内酰胺酶稳定; 抗厌氧菌。 | 美国、米国等西方国家要倒霉 |
| 3. 氧头孢烯类 | 拉氧头孢 \approx 三代头孢 | 广——多种 G- 菌 + 厌氧菌。 | |

· 14 ·

考点 49 万古霉素

| | |
|------|---|
| 抗菌谱 | ① G+ 球菌——葡萄球菌(包括耐甲氧西林金黄色葡萄球菌 MRSA)、肠球菌、肺炎、溶血性与草绿色链球菌; ② 厌氧菌 G+ 杆菌——炭疽杆菌、白喉棒状杆菌、破伤风杆菌; ③ G- 菌——弱。 |
| 临床应用 | ① 耐药 G+ 菌所致严重感染, 特别是甲氧西林耐药葡萄球菌属(MRSA 及 MRCNS)、肠球菌属及青霉素耐药肺炎链球菌所致败血症、心内膜炎、脑膜炎、肺炎、骨髓炎等; ② 青霉素过敏或经其他抗生素治疗无效的严重 G+ 菌感染患者; ③ 口服万古霉素——甲硝唑治疗无效的艰难梭菌所致假膜性肠炎; ④ 中性粒细胞减少或缺乏症合并 G+ 菌感染者。 |
| 不良反应 | ① 肾毒性 ② 耳毒性 ③ 红人综合征: 万古 / 去甲万古可出现。替考拉宁少见 ④ 过敏、抗生素相关腹泻 |

考点 50 喹诺酮类抗菌药物

| | |
|------|--|
| 代表药物 | 氟喹诺酮类, 抗菌作用增强, 抗菌谱更广, 包括诺氟沙星、环丙沙星、氧氟沙星、左氧氟沙星、洛美沙星、氟罗沙星、司帕沙星; |
| 抗菌谱 | 需氧 G- 杆菌抗菌活性尤其高, 对铜绿假单胞菌属有效。左氧氟沙星、莫西沙星——可联合用于根除幽门螺杆菌。结核分枝杆菌和非典型分枝杆菌。沙眼衣原体、支原体、军团菌; |



| | |
|------|---|
| 主要应用 | <p>广谱: G^+、G^-、衣原体、支原体; 尤其对 G^- 杆菌 (如: 铜绿假单胞菌) 作用强 可透过血 - 脑屏障, 在治疗某些严重的感染性脑膜炎 适用于泌尿系感染, 但注意莫西沙星不宜用 (莫西沙星可用于社区获得性肺炎) 左氧氟沙星、莫西沙星——根除幽门螺杆菌</p> |
|------|---|

典不良反应和禁忌

1. **关节病变**——肌肉痛、腱鞘炎、跟腱炎、肌腱撕裂等疼痛与肿胀, 立即停药并就医。因此——孕妇和儿童禁用——影响 18 岁以下儿童软骨发育。
2. **心脏毒性**——使心电图 Q-T 间期延长。
3. **血糖紊乱**——血糖增高或降低。
4. **中枢神经系统症状**——头痛、头晕、睡眠不良, 并可致精神症状。视觉紊乱: 双视、色视。因此——脑动脉硬化、癫痫患者禁用, 可致癫痫发作。
5. 光敏反应。
6. 肝肾损害。因此——肝肾功能不全者禁用。
7. 假膜性肠炎, 可轻度至危及生命——轻者停药可恢复, 中、重度患者应予以抗艰难梭菌治疗 (如甲硝唑)。
8. 胃肠道反应。
9. 过敏反应。Stevens-Johnson 及 Lyell 综合征。

