

2007年执业药师考试考点汇总与解析-药理学-抗帕金森病药 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/266/2021\\_2022\\_\\_EF\\_BC\\_92\\_EF\\_BC\\_90\\_EF\\_BC\\_90\\_EF\\_c23\\_266667.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/266/2021_2022__EF_BC_92_EF_BC_90_EF_BC_90_EF_c23_266667.htm) 抗帕金森病药

**考点1：左旋多巴（L-多巴）**左旋多巴是左旋酪氨酸合成儿茶酚胺的中间产物，是DA的前体物质，左旋多巴本身无药理活性，进入中枢脱羧成多巴胺后才起治疗作用。【药动学】口服后通过主动转运系统从小肠上端迅速吸收，0.5~2h达血药峰浓度。胃排空延缓或胃内酸度增加等因素可降低其生物利用度。左旋多巴吸收后首次通过肝脏时大部分被脱羧，小部分在肠、心脏和肾中脱羧生成多巴胺。血液中只有1%左右的左旋多巴进入中枢转化成多巴胺。如同时合用外周脱羧酶抑制剂，可减少左旋多巴的用量，使进入中枢的左旋多巴量增多。代谢产物由肾迅速排泄。血浆 $t_{1/2}$ 为1~3h。【药理作用】1. 抗帕金森病。左旋多巴进入中枢后转变为多巴胺，补充纹状体中多巴胺的不足，使多巴胺和乙酰胆碱两种递质重新取得平衡，而产生治疗震颤麻痹的作用。左旋多巴的作用特点是：（1）奏效较慢，用药2~3周后才出现体征的改善，1~6个月后才获得最大疗效，连续用药1年以上约75%以上的患者可获得较好的疗效。（2）对轻症及年轻患者疗效较好，而对重症及年老衰弱者疗效较差。（3）对肌肉僵直及少动的疗效较好，而对肌震颤的疗效较差。2. 心血管系统作用。左旋多巴在外周脱羧形成多巴，可引起轻度直立性低血压，短暂心动过速，轻度心律失常。长期服用后，上述症状可自行消失。3. 内分泌系统作用。中枢多巴胺作用于垂体腺细胞，促进催乳素抑制因子释放，减少催乳素的分泌。

**【临床应用】** 1. 治疗帕金森病。左旋多巴可广泛用于治疗各种类型帕金森病，但对吩噻嗪类抗精神病药引起的帕金森综合征无效。 2. 治疗肝昏迷。肝昏迷的伪递质学说认为，正常机体蛋白质代谢产物苯乙胺和酪胺都在肝内被氧化解毒，肝功能障碍时，血中苯乙胺和酪胺升高，在神经细胞内经羟化酶作用，分别生成伪递质苯乙醇胺和羟苯乙胺，取代正常的递质去甲肾上腺素，妨碍神经系统的正常功能而发生昏迷。服用左旋多巴，在脑内转变成去甲肾上腺素，恢复正常的神经活动，从而使肝昏迷患者意识苏醒，但不能改善肝功能，故不能根治。

**【不良反应】** 1. 胃肠道反应。治疗初期约80%出现恶心、呕吐和食欲减退等。这是由于DA刺激延脑催吐化学感受区所致。随着继续用药，胃肠道的不良反应可逐渐消失。偶见溃疡出血或穿孔，应予注意。与外周脱羧酶抑制剂同服，可使胃肠道反应明显减少。 2. 心血管反应。左旋多巴在外周脱羧形成的多巴胺，可引起轻度体位性低血压，继续服药可因耐受性而逐渐减轻或消失。由于DA可兴奋受体，故可引起心律失常。少数患者出现眩晕。 3. 精神障碍。表现为失眠、焦虑、恶梦、狂躁等兴奋症状，尤其是高龄者可出现幻觉、妄想等，需减量或停药。 4. 异常不随意运动。长期用药半数以上的病人可引起不随意运动，如高龄者多见头颈部不规则扭动、张口、咬牙、伸舌、皱眉等，年轻患者出现舞蹈样异常运动。部分持续服药1年以上的患者可出现“开关”现象，即突然多动不安（开），而后又出现全身性或肌强直性运动不能（关），两种现象可交替出现，多见于年轻患者，应适当减少剂量。消化道溃疡、高血压、精神病、糖尿病、心律失常及闭角型青光眼患者禁用。维

生素B6是多巴脱羧酶的辅基，可增强左旋多巴的外周副作用。禁与单胺氧化酶抑制剂、麻黄碱、利舍平以及拟肾上腺素药合用。

**考点2：卡比多巴（-甲基多巴胍复方左旋多巴）**【药理作用】为外周左旋芳香氨基酸脱羧酶抑制剂，不能通过血脑屏障而进入脑，故和左旋多巴合用时，仅抑制外周的左旋多巴转化为多巴胺，使循环血中左旋多巴含量增高5~10倍，因而可使较多的左旋多巴到达黑质-纹状体而发挥作用，从而提高左旋多巴的疗效。同时又可减轻左旋多巴在外周的不良反应。卡比多巴是左旋多巴的重要辅助药。将卡比多巴与左旋多巴按1：10的剂量合用（如信尼麦片，Sinemet，每片含卡比多巴10mg，左旋多巴100mg，或卡比多巴25mg，左旋多巴250mg），可使左旋多巴的有效剂量减少75%，从而明显减轻或防止左旋多巴对心脏的毒副作用。同时，由于进入脑中的左旋多巴量增多，在治疗开始时能更快地达到左旋多巴的有效剂量。卡比多巴单独使用无明显药理作用。

【临床应用】适用于治疗自发的帕金森病脑炎后帕金森综合征、症状性帕金森综合征（一氧化碳或锰中毒）、服用含比多辛（维生素B6）的维生素制剂引起的帕金森病或帕金森综合征的患者，对以前用过左旋多巴/脱羧酶抑制剂复合制剂或单用左旋多巴治疗的有剂末作用减退（渐弱）现象、峰剂量运动障碍、运动不能等特征的运动失调，或有类似短时间运动障碍现象的患者，减少“关”的时间。

100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)