

药理学地西洋药师资格考试 PDF转换可能丢失图片或格式，
建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/510/2021_2022__E8_8D_AF_E7_90_86_E5_AD_A6_E2_c23_510578.htm

俗称：安定，苯甲二氮，valium，diapam，stesolid，stesolin 药物简介 【性状】白色或类白色的结晶性粉末；无臭，味苦。在乙醇中溶解，在水中几乎不溶。 【药理及应用】本品为苯二氮类抗焦虑药，具有抗焦虑、镇静、催眠、抗惊厥、抗癫痫及中枢性肌肉松弛作用。其抗焦虑作用选择性很强，是氯氮的5倍，这可能与选择性地作用于大脑边缘系统，与中枢苯二氮受体结合而促进 γ -氨基丁酸（gaba）的释放或促进突触传递功能有关。较大剂量时可诱导入睡，与巴比妥类催眠药比较，它具有治疗指数高、对呼吸影响小、对快波睡眠（rem）几无影响，对肝药酶无影响、大剂量时亦不引起麻醉等特点，是目前临床上最常用的催眠药。此外还具有较好的抗癫痫作用，对癫痫持续状态极有效，静脉注射时可使70%~80%的癫痫得到控制，但对癫痫小发作及小儿阵挛性发作不如硝西洋。中枢性肌肉松弛作用比氯氮强，为其5倍，而抗惊厥作用很强，为氯氮的10倍。口服吸收快，约1小时达血高峰浓度，肌注后吸收不规则而慢，静脉注射迅速进入中枢而生效，但快速再分布，故而持续时间短。血浆 $t_{1/2}$ 为20~50小时。经肝脏代谢为奥沙西洋，仍有生物活性，故连续应用可蓄积。可透过胎盘屏障进入胎儿体内。主要自肾脏排出，亦可从乳汁排泄。临床应用用于治疗： 焦虑症及各种神经官能症。 失眠：尤对焦虑性失眠疗效极佳。 癫痫：可与其它抗癫痫药合用，治疗癫痫大发作或小发作，控制癫痫持续状态时应静脉注射。

各种原因引起的惊厥：如子痫、破伤风、小儿高烧惊厥等。脑血管意外或脊髓损伤性中枢性肌强直或腰肌劳损、内镜检查等所致肌肉痉挛。【用法】口服：抗焦虑：每次2.5~5mg，每日3次。严重状态时可增至每日15~30mg，分次服。催眠：每次5~10mg，睡前服用。抗癫痫：见本章第6节。抗惊厥：成人每次2.5~10mg，每日2~4次。6个月以上儿童，每次0.1mg/kg，每日3次。肌肉或缓慢静脉注射：每次10~20mg，必要时，4小时再重复1次。【注意】（1）本品有嗜睡、轻微头痛、乏力、运动失调，与剂量有关。老年患者更易出现以上反应。偶见低血压、呼吸抑制、视力模糊、皮疹、尿潴留、忧郁、精神紊乱、白细胞减少。高剂量时少数人出现兴奋不安。（2）长期应用可致耐受与依赖性，突然停药有戒断症状出现。宜从小剂量用起。（3）青光眼、重症肌无力等患者慎用。新生儿、哺乳期妇女、孕妇（尤其妊娠开始3个月及分娩前3个月）忌用，粒细胞减少、肾功能不良者慎用。老年人剂量减半。【药物相互作用】（1）能增强其它中枢抑制药的作用，若同时应用应注意调整剂量。酒精能增强本品作用，治疗期间应避免饮酒或含酒精的饮料。（2）西咪替丁可抑制本品和氯氮的排泄，合用时，应注意调整剂量。百考试题网站整理（3）本品可增加筒箭毒、三碘季胺酚的作用，但可减弱琥珀胆碱的肌肉松弛作用。（4）苯妥英钠与本品合用，可减慢苯妥英钠的代谢，而利福平又可增加本品的排泄。"#F8F8F8" 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