

药理学

第八章

中枢神经系统药理学概论

主讲人：秦婷



蓝鲸医考

第八章 中枢神经系统药理学概论

本章知识结构

- 一、中枢神经系统的构成与功能
- 二、中枢神经系统的递质及其受体



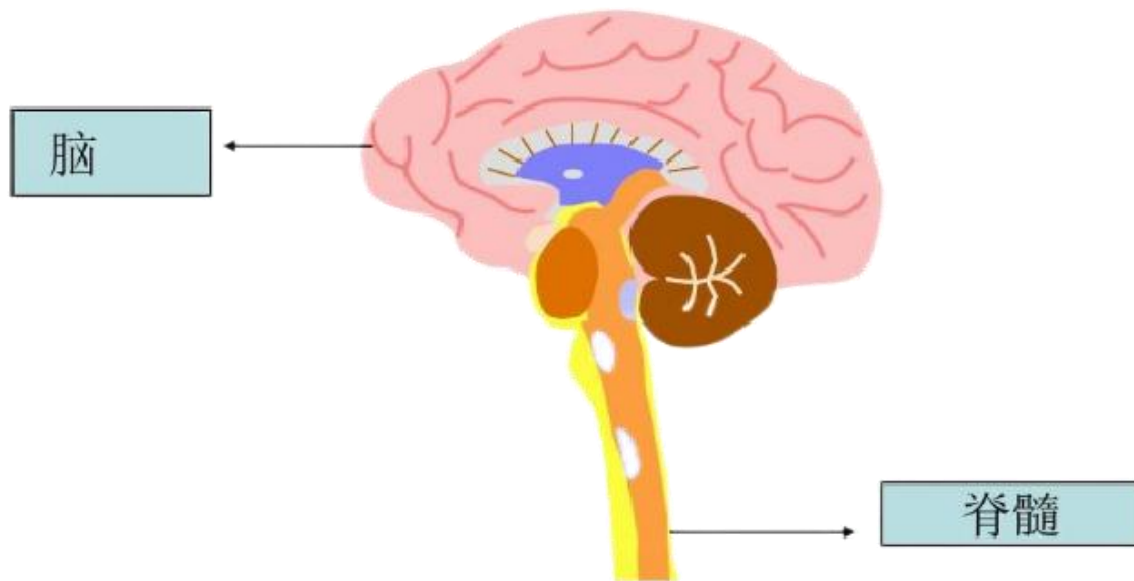
第八章 中枢神经系统药理学概论

本章重点

- 重点内容：中枢神经系统重要递质及其受体的分布、生理功能及相关药物作用机制。
- 一般重点内容：中枢神经系统的构成与功能；熟悉相关神经精神疾病的发病机制与治疗药物。

第八章 中枢神经系统药理学概论

一、中枢神经系统的构成与功能



第八章 中枢神经系统药理学概论

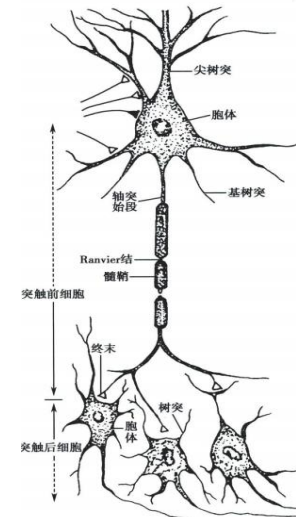
一、中枢神经系统的构成与功能

(一) 神经元

神经元是CNS的基本结构与功能单位。

大多数神经元通过突触相互连接形成网络，并通过生物电和化学物质传递信息，有的神经元还具有内分泌和/或旁分泌功能。

典型的神经元结构包括细胞体和突起，突起又可分为树突或轴突。



第八章 中枢神经系统药理学概论

一、中枢神经系统的构成与功能

(二) 突触与信息传递

神经元与神经元或其他效应细胞间发生信息传递的部位称为突触。根据突触传递的方式和特点，可分为电突触、化学突触和混合性突触。

在CNS中，大部分突触为化学突触，是CNS药物作用的主要部位。

神经递质是通过化学突触将信号从一个神经元传递给另一个神经元或效应细胞的特定内源性化学物质。

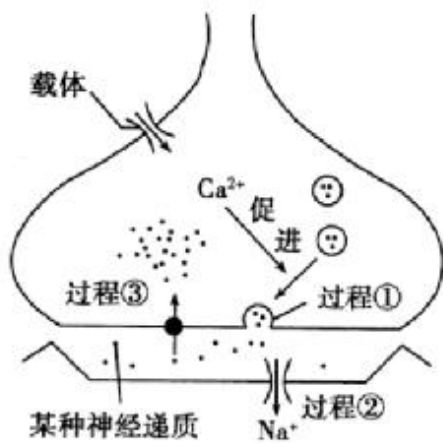
突触前神经元将合成或摄取的神递质储存在突触囊泡内。

第八章 中枢神经系统药理学概论

一、中枢神经系统的构成与功能

(二) 突触与信息传递

“电（导致 Ca^{2+} 内流）—化学—电”传递。神经递质的作用可通过三个途径被中止：酶解、重摄取和弥散。



第八章 中枢神经系统药理学概论

一、中枢神经系统的构成与功能

(三) 神经环路

一个神经元接受多个其他神经元轴突末梢的突触传递，这种多信息影响同一个神经元的神经环路称为聚合环路。一个神经元也可以同时与多个神经元建立突触传递，使信息扩散，这种神经环路称为发散环路。

第八章 中枢神经系统药理学概论

一、中枢神经系统的构成与功能

（四）神经胶质细胞

脑内细胞除神经元外，约有90%细胞是神经胶质细胞。CNS中的神经胶质细胞按形态可分为星形胶质细胞、少突胶质细胞和小胶质细胞等类型。

神经胶质细胞对神经元不仅起到支持、营养和绝缘等作用，还参与调节突触传递、突触可塑性等过程。

第八章 中枢神经系统药理学概论

一、中枢神经系统的构成与功能

(五) 血脑屏障

血脑屏障是指血液—脑组织间液之间的天然结构屏障。BBB由毛细血管内皮细胞、包绕毛细血管的星形胶质细胞以及周细胞组成。BBB能阻断血液中**大部分疏水性物质**直接扩散进入脑组织或脑脊液，防止病原体的侵入，从而保证脑组织内环境稳定。

第八章 中枢神经系统药理学概论

二、中枢神经系统的递质及其受体

（一）乙酰胆碱

乙酰胆碱（ACh）是最早被发现的神经递质，也是CNS中主要的神经递质。

CNS 中胆碱能神经元胞体集中分布于3个区域：

1. 基底前脑和中脑（脚间/脑桥被盖核）：海马是参与学习记忆的重要脑区，如阿尔茨海默病。
2. 纹状体：如苯海索用于帕金森病。
3. 脑干和脊髓的传出神经：脑干和脊髓发出的自主神经、运动神经都是胆碱能神经。

第八章 中枢神经系统药理学概论

二、中枢神经系统的递质及其受体

(二) 去甲肾上腺素

1. 神经元分布与功能

去甲肾上腺素能神经元主要分布于脑桥及延髓的网状结构。LC（蓝斑核）中的NA系统在多种生理活动中起重要作用，可能与睡眠—觉醒、注意力、学习记忆、应激反应、体温降低、摄食行为、痛觉、心血管调节及情绪状态等多种神经精神功能有关。中枢 NA系统功能异常与睡眠障碍、抑郁症、焦虑症、注意力缺乏/多动症等密切相关。

第八章 中枢神经系统药理学概论

二、中枢神经系统的递质及其受体

(二) 去甲肾上腺素

2. 相关疾病与作用药物

- (1) **情感障碍性疾病**：大多数抗抑郁药、碳酸锂。
- (2) **疼痛与镇痛**： α_2 受体激动药如可乐定和右美托咪定、抑制NA再摄取的抗抑郁药。
- (3) **阿片戒断症状**：可乐定、洛非西定等。
- (4) **中枢抗高血压药物**：可乐定、甲基多巴、普萘洛尔。

第八章 中枢神经系统药理学概论

二、中枢神经系统的递质及其受体

(三) 多巴胺

1. 神经元分布与功能：DA 能神经元参与大脑的运动控制、情感思维和神经内分泌功能，与 PD、精神分裂症、药物成瘾密切相关。
2. 受体类型及作用药物：麦角类衍生物和非麦角类药物主要激动 D_2 样受体，作用于黑质—纹状体通路，用于PD的治疗。经典抗精神分裂症药氯丙嗪、氟哌啶醇等主要通过拮抗中脑—边缘和中脑—皮质通路的 D_2 样受体而治疗精神分裂症阳性症状。

第八章 中枢神经系统药理学概论

二、中枢神经系统的递质及其受体

(四) 5-羟色胺

1. 神经元分布与功能：脑内5-HT能神经元相对数量较少，集中分布于脑干的中缝核群。这些神经元的轴突组成5-HT 能神经的上行及下行纤维，参与睡眠、觉醒、心境和情感行为的调控。
2. 相关疾病与药物：中枢神经系统 5-HT功能异常可能与厌食、紧张、偏头痛、抑郁症、精神分裂、癫痫、PD、AD等多种神经精神疾病有关。

第八章 中枢神经系统药理学概论

二、中枢神经系统的递质及其受体

（五）组胺

HA受体分为H₁、H₂和H₃受体，H₁受体可能与觉醒有关。H₂受体拮抗药**佐兰替丁**可透过血脑屏障，目前仅作为工具药物用于研究。H₃受体反向激动药被用于治疗**发作性睡病**。

（六）谷氨酸

谷氨酸是 CNS 中含量最高的氨基酸，是主要的**兴奋性**递质。

在疾病状态下，胞外兴奋性氨基酸浓度异常增高，引起神经元过度兴奋，最终造成神经元死亡，称为**兴奋性毒性**。

第八章 中枢神经系统药理学概论

二、中枢神经系统的递质及其受体

(七) γ -氨基丁酸

γ -氨基丁酸 (GABA) 为中枢主要的抑制性神经递质，但在发育中的大脑，GABA为**兴奋性**神经递质。脑内GABA能神经元发挥广泛作用，参与**调节痛觉、食欲和心血管活动**等行为和生理反应。

地西洋通过与 α 亚基结合，**增强GABA与GABA_A受体的亲和力**，增加Cl⁻通道开放频率，产生抗焦虑、镇静催眠、抗惊厥的作用。反之，氟马西尼与 α 亚基结合后产生**拮抗GABA**的作用，用于解救苯二氮草类药物中毒，也可诱导焦虑、惊厥。

第八章 中枢神经系统药理学概论

二、中枢神经系统的递质及其受体

(八) 神经肽

神经肽主要以神经激素的方式，经弥散方式作用于较远距离的靶细胞，调节神经网络的活动。

阿片肽家族包括脑啡肽、强啡肽、 β -内啡肽及孤啡肽。 β -内啡肽、脑啡肽及强啡肽分别对 μ 、 σ 和 κ 阿片受体有高亲和性，孤啡肽选择性地作用于孤阿片受体。

阿片肽受体主要生理功能是调制痛觉。阿片肽对运动、呼吸、心血管、胃肠道、内分泌以及免疫系统的功能都有调节作用。

第八章 中枢神经系统药理学概论

例题讲解

【单选题】能增强GABA能神经元的传递作用，产生抗焦虑、镇静催眠等作用的药物是（ ）。

- A. 单胺氧化酶抑制剂
- B. 丙米嗪
- C. 氯丙嗪
- D. 苯二氮草类

第八章 中枢神经系统药理学概论

例题讲解

【单选题】能增强GABA能神经元的传递作用，产生抗焦虑、镇静催眠等作用的药物是（ ）。

- A. 单胺氧化酶抑制剂
- B. 丙米嗪
- C. 氯丙嗪
- D. 苯二氮草类

【答案】D

本章完!

加油，考编路上的孤勇者!

关注蓝鲸医考 更多资料 等你来拿!

公众号



客服微信



药理学

第九章 镇静催眠药

主讲人：秦婷



蓝鲸医考

第九章 镇静催眠药

本章知识结构

- 一、镇静催眠药概述
- 二、苯二氮草类药物
- 三、巴比妥类药物
- 四、新型非苯二氮草类药物
- 五、其他镇静催眠药



第九章 镇静催眠药

本章重点

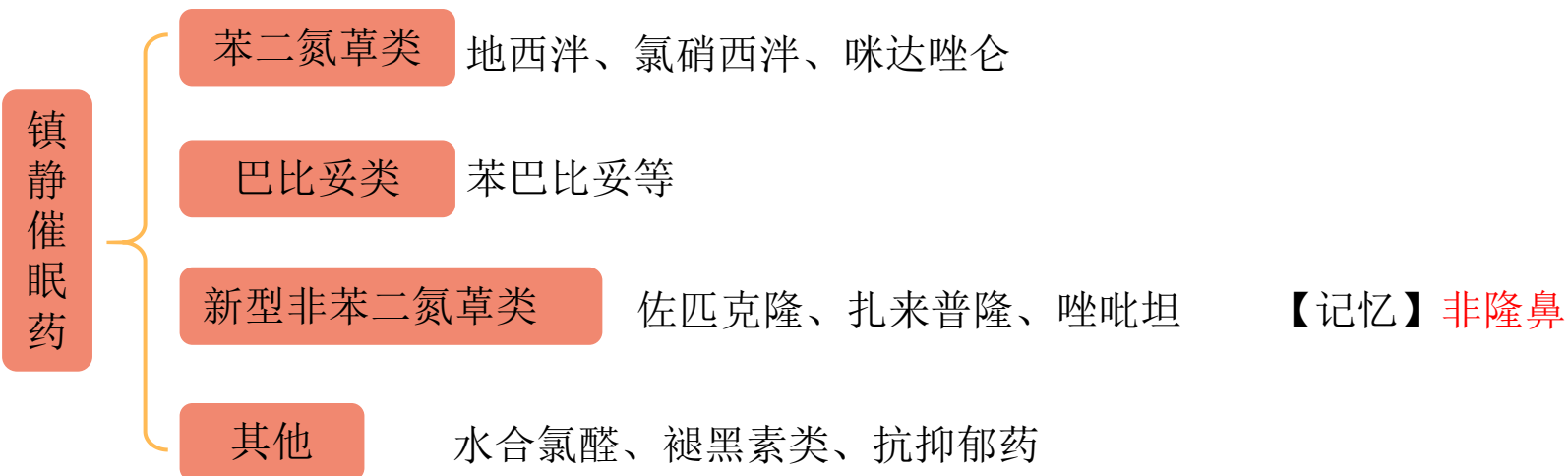
- 重点内容：镇静催眠药分类，地西洋和氟马西尼的药理作用、作用机制、主要临床应用和不良反应。
- 一般重点内容：地西洋、佐匹克隆、唑吡坦、咪达唑仑的适应证、作用特点、用法用量、禁忌证和具有临床意义的药物相互作用。
- 非重点内容：其他镇静催眠药的作用特点及应用。

第九章 镇静催眠药

一、镇静催眠药概述

1. 概念：能够引起镇静和近似生理睡眠的药物，称为镇静催眠药。

2. 分类



第九章 镇静催眠药

一、镇静催眠药概述

3. 药理作用共同特点

(1) 剂量不同，药理作用不同

镇静催眠药从小剂量开始逐渐增大剂量，对中枢的抑制作用逐渐加强，依次可产生抗焦虑、镇静、催眠、抗惊厥、抗癫痫作用。巴比妥类药物大剂量可诱导麻醉，甚至导致昏迷、死亡。

(2) 反复用药易产生耐受性和依赖性

第九章 镇静催眠药

一、镇静催眠药概述

3. 药理作用共同特点



- 爸比不焦虑
- 笨蛋儿子找不到妈妈
- 克隆羊没有爹妈
- 唑吡坦是孤儿，只喜欢一个人睡

类别	抗焦虑	镇静催眠	抗惊厥	抗癫痫	麻醉	肌松作用
巴比妥类	无	有	有	有	有	无
苯二氮草类	有	有	有	有	无	有
佐匹克隆	有	有	有	无	无	有
唑吡坦	无	有	无	无	无	无

第九章 镇静催眠药

二、苯二氮草类药物

(一) 分类

根据药物作用所维持的时间，可以将苯二氮草类药物分为3类：

- (1) **长效类**：如**地**西洋、**氟**西洋。【福地长】
- (2) **中效类**：如**氯**硝西洋、**艾**司唑仑。【爱绿洲】
- (3) **短效类**：如**咪**达唑仑、**三**唑仑。【三米短】

第九章 镇静催眠药

二、苯二氮草类药物

(二) 药动学

BZ虽与蛋白结合率较高，如地西洋血浆蛋白结合率可达99%但因其具有较高的脂溶性，静脉注射后可迅速分布于脑组织，随后再分布蓄积于脂肪和肌组织，所以中枢抑制作用出现快且维持时间短。

该类物质主要经肝药酶代谢，主要的活性代谢产物为去甲地西洋和奥沙西洋。

(三) 作用机制

为增强GABA与GABA_A受体的结合效应，使Cl⁻通道开放的频率增加，增强GABA能神经的传递功能和突触抑制效应。【记忆：一个蛋】

第九章 镇静催眠药

二、苯二氮草类药物

(四) 药理作用

- (1) **抗焦虑作用**：BZ在小于镇静剂量时就显著改善上述症状。
- (2) **镇静和催眠作用**：小剂量表现镇静作用，较大剂量产生催眠作用。
- (3) **抗惊厥和抗癫痫作用**：抗惊厥作用地西洋和三唑仑的作用比较明显。临床上常用于子痫、破伤风、小儿高热等所致惊厥。地西洋（开始10mg，隔10~15分钟酌情增加，可达到最大剂量）是目前治疗**癫痫持续状态**的首选药。

第九章 镇静催眠药

二、苯二氮草类药物

(4) 中枢性肌肉松弛作用

(5) 治疗癔病：极度兴奋躁动者，可肌肉注射地西洋或氯丙嗪。

(五) 不良反应：BZ毒性较小、安全范围大，很少因用药剂量过大而引起死亡。

(1) 催眠剂量BZ可致眩晕和困倦、头昏、乏力和精细运动不协调等。

(2) 大剂量致共济失调、运动功能障碍、言语含糊不清，甚至昏迷和呼吸抑制。

(3) 静脉注射过快产生心血管和呼吸抑制作用。

(4) 长期服用该类药物有耐受性、依赖性。

第九章 镇静催眠药

二、苯二氮草类药物

(5) 停药可出现失眠、焦虑、兴奋、心动过速、呕吐、震颤，偶有皮疹和白细胞减少等。但戒断症状发生比巴比妥类药物轻。

【禁忌证】老年患者、肝肾功能不全者、驾驶员、高空作业者、青光眼患者及重症肌无力者慎用。

另：苯二氮草受体拮抗药氟马西尼可用于BZ过量的诊断和治疗，还用于改善酒精性肝硬化患者的记忆缺失等症。【记忆】笨蛋在玩稀泥巴

第九章 镇静催眠药

三、巴比妥类药物

(一) 分类

长效：苯巴比妥。

中效：异戊巴比妥。

短效：司可巴比妥。

超短效：硫喷妥钠。

【记忆】长本一中，断食潮流

第九章 镇静催眠药

三、巴比妥类药物

(二) 作用机制

巴比妥类药物可激动GABA_A受体，增加Cl⁻内流的时间，通常在无GABA 时，高浓度巴比妥类药物也能直接激活Cl⁻通道，增加Cl⁻内流。

【记忆】绿粑粑

(三) 药理作用

- (1) 镇静和催眠：易引起严重不良反应，不推荐作为失眠的常规治疗药物。
- (2) 抗惊厥：经常采用肌肉注射给药。

第九章 镇静催眠药

三、巴比妥类药物

(3) 抗癫痫

(4) 治疗高胆红素血症和肝内胆汁淤积性黄疸：巴比妥类药物均能诱导肝药酶生成，其中苯巴比妥作用最强。

巴比妥类药物进入脑组织中神经系统的快慢取决于药物的脂溶性大小，脂溶性高的药物出现中枢抑制作用快，起效快，比如异戊巴比妥；脂溶性低的药物出现中枢抑制慢，起效慢，比如苯巴比妥。

(四) 不良反应

1. 常见嗜睡、精神依赖性、步履蹒跚、肌无力等“宿醉”现象。

第九章 镇静催眠药

三、巴比妥类药物

2. 长期用药有依赖性，表现为强烈要求继续使用药物或增加剂量，或出现心因性依赖、戒断综合征。
3. 可能导致过敏，易出现皮疹，严重者可能出现剥脱性皮炎和史蒂文斯-约翰综合征，可能致死，所以一旦出现皮疹，应立即停药。
4. 快速静脉注射可致呼吸抑制、心律失常甚至昏迷等反应。

第九章 镇静催眠药

四、新型非苯二氮草类药物

1. 佐匹克隆

为环吡咯酮类药物，其异构体为艾司佐匹克隆。

适用于各种情况引起的失眠症。具有起效快、半衰期短、成瘾性小、毒性低的特点。成人常用量，睡前口服7.5mg，重症可增至15mg。

2. 唑吡坦

属于咪唑并吡啶结构。

选择性高，仅具有镇静催眠作用，无抗焦虑、肌肉松弛和抗惊厥等作用。

第九章 镇静催眠药

四、新型非苯二氮草类药物

主要用于原发性失眠症和精神分裂症、躁狂或抑郁等引起的睡眠障碍。长期服用耐受性、依赖性和戒断症状较轻。

3. 扎来普隆

主要用于成年人及老年人失眠的短期治疗。

半衰期短，几乎不会出现宿醉现象。

第九章 镇静催眠药

五、其他镇静催眠药

1. 水合氯醛

【药理作用】催眠剂量30分钟内即可诱导入睡，催眠作用温和，不缩短REMS时间。较大剂量有抗惊厥作用。大剂量可引起昏迷和麻醉，抑制延髓呼吸及血管运动中枢，导致死亡。

【临床应用】

- (1) 治疗失眠，适用于入睡困难的患者。
- (2) 麻醉前、手术前和睡眠脑电图检查前用药。
- (3) 抗惊厥，用于癫痫持续状态的治疗，也可用于小儿高热、破伤风及子痫引起的惊厥。

第九章 镇静催眠药

五、其他镇静催眠药

2. 丁螺环酮：各种焦虑症。

口服开始一次5mg，一日2~3次。第二周可加至一次 10mg，一日2~3次。常用治疗剂量一日20~40mg。

第九章 镇静催眠药

例题讲解

【单选题】下列苯二氮草类药物中，作用时间最短的是（ ）。

- A. 氯氮草
- B. 三唑仑
- C. 地西洋
- D. 氟西洋

第九章 镇静催眠药

例题讲解

【单选题】下列苯二氮草类药物中，作用时间最短的是（ ）。

- A. 氯氮草
- B. 三唑仑
- C. 地西洋
- D. 氟西洋

【答案】B

本章完!

加油，考编路上的孤勇者!

关注蓝鲸医考 更多资料 等你来拿!

公众号



客服微信

