

药理学考前辅导笔记（四）PDF转换可能丢失图片或格式，
建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/169/2021_2022__E8_8D_AF_E7_90_86_E5_AD_A6_E8_c23_169558.htm 第十五章 抗帕金森病药

掌握左旋多巴和苯海索的药理作用、药动学特点、临床应用及主要不良反应。了解常用复方制剂的药理作用。震颤麻痹又称帕金森病，主要病变在黑质和纹状体。纹状体有来自黑质起抑制作用大多巴胺（DA）能神经，还有来自其它部位起兴奋作用胆碱能神经。在生理情况下，这两种神经在功能上相互拮抗，共同调节运动机能，维持平衡状态。当黑质中多巴胺神经元变性后，多巴胺神经能不足，而胆碱能神经相对占优势，从而出现震颤麻痹症状。【分类】1.原发性震颤麻痹（帕金森病）2.继发性震颤麻痹（帕金森综合征）

【病因】1.DA神经元变性，导致DA不足，ACh相对兴奋
2.NE神经元变性，导致NE不足
3.组胺和5-羟色胺之间的平衡被破坏
4.MAO-B能氧化MPTP、DA等物质，使其变成神经毒

【治疗】1.补充DA或激动DA受体，抑制或阻断ACh的作用
2.补充NE的前体物
3.应用抗组胺药，补充5-羟色胺的前体物
4.MAO-B抑制剂和维生素E等抗氧化药物

根据上述发病机制，抗震颤麻痹药有 拟多巴胺类药和 中枢性抗胆碱药

一、拟多巴胺类药 左旋多巴 [作用与用途] 抗震颤麻痹 少量（1%左右）进入脑内当左旋多巴，经多巴脱羧酶脱羧转变为多巴胺而发挥作用，余下大部分在脑外生成多巴胺引起不良反应。

[作用特点] 1、对多数患者有效，对轻症，较年轻患者疗效较好。 2、改善肌肉僵直及运动困难效果较好，对肌震颤效果差。 3、对抗精神病药吩噻嗪类引起对锥体外系反应无

效。4、显效慢，1~6个月显示最大疗效。[不良反应] 1、胃肠反应最常见，消化性溃疡慎用。2、心血管反应可出现体位性低血压，心律失常。3、精神障碍不安、焦虑、失眠。4、不自主的异常运动和“开关现象” [药物相互作用] 1、VitB6可增强多巴胺脱羧酶活性，故左旋多巴与VitB6合用其外周不良反应增强。2、与外周多巴脱羧酶抑制剂 - 甲基多巴肼或苄丝肼合用可增加疗效。3、抗精神病药（如吩噻嗪类、丁酰苯类）禁与左旋多巴合用，因前者阻断DA受体。外周多巴脱羧酶抑制剂 【常用药】 1.卡比多巴(α -甲基多巴肼) 2.盐酸苄丝肼(色拉肼) 复方左旋多巴制剂 【常用药】 1.心宁美(信尼麦)：卡比多巴左旋多巴 2.复方苄丝肼(美多巴)：盐酸苄丝肼左旋多巴 溴隐亭 【特点】 1.直接激动DA受体 2.左旋多巴或其复方制剂无效，本品常可有效 3.可与左旋多巴复方制剂合用 金刚烷胺对多型震颤麻痹有效，机制可能是促使脑中多巴胺的释放，与左旋多巴合用有协同作用。二、中枢性抗胆碱药（单胺氧化酶B抑制药）苯海索（安坦） [作用与用途] 中枢抗胆碱作用较强，而外周抗胆碱作用约为阿托品的1/10~1/2。用于震颤麻痹，疗效较左旋多巴和金刚烷胺差，适用于轻症，也可作为左旋多巴治疗的辅助药物。对抗精神病药引起的震颤麻痹（锥体外系反应）有效。 [不良反应] 较阿托品少 第十六章 镇痛药 掌握吗啡和哌替啶的药理作用、药动学特点、临床应用及主要不良反应。熟悉吗啡的作用机制，依赖性产生原理及其防治。了解其他镇痛药和阿片受体拮抗剂的药理作用特点。 【病因】各种形式的伤害刺激作用于神经末梢均可引起疼痛(锐痛、钝痛)。 【镇痛药分类】分为强镇痛药和解热镇痛抗炎药两大类。强镇痛药镇痛效果强

，主要缺点反复应用容易导致成瘾，属麻醉药品，应严格控制使用。

第一节 阿片类药物

阿片类药物具有强大的镇痛用，反复应用易于成瘾，故又称成瘾性镇痛药(或麻醉性镇痛药.麻醉性药品)

吗啡 (Morphine) [药理作用]

1、 中枢神经系统:

(1) 镇痛、镇静 吗啡具有很强的镇痛作用,对持续性钝痛较间歇性强. A皮下注射5-10mg,可持续4-5小时。 B镇痛范围广,各种疼痛均有效。 C镇痛时,意识及其它感觉不受影响具有明显的镇痛作用和欣快感,消除焦虑、紧张、恐惧等,提高疼痛的耐受性。如外界环境安静,可致入睡。 D镇痛机制:与不同脑区(脑室导管周围灰质、丘脑、脊髓背角胶质区等)的阿片受体(吗啡受体)结合,模拟内阿片肽(脑啡肽、 δ -内啡肽、强啡肽)的用。

(2)镇咳 为抑制咳嗽中枢所致 (3)抑制呼吸 A降低呼吸中枢对CO₂的敏感性治疗量:呼吸频率减慢;中毒量:呼吸衰竭死亡。 B由于抑制呼吸,新生儿、婴儿易中毒死亡,肺气肿、肺心病禁用 (4)其它 A催吐:初次使用时可出现恶心、呕吐、反复使用可减轻。 B缩瞳:针尖样瞳孔为中毒特征

2、 心血管系统

(1) 扩张外周容量血管及阻力血管,其机制与促进组胺释放和中枢交感张力降低有关 (2) 由于抑制呼吸引起二氧化碳潴留,继发性引起脑血管扩张、脑脊液压力高

3、 平滑肌

(1) 强大、持久地兴奋胃肠道平滑肌,使蠕动减少,此外还能抑制消化液分泌,可导致便秘. (2) 胆道括约肌痉挛性收缩,使胆道内压升高和诱发胆绞痛. (3) 输尿管收缩. (4) 支气管平滑肌收缩,可诱发哮喘发作. (5) 膀胱括约肌张力提高,导致尿潴留

[临床应用]

1、 镇痛

(1) 用于其它镇痛药无效的急性锐痛; (2)胆绞痛、肾绞痛宜合用阿托品. 2、 心源性哮喘 (1) 措施:吸氧、应用速效强心甙、氨茶碱配以吗啡,以改善症状. (2) 吗啡用于心源性哮

喘的机制: A扩张外周血管,减轻回心血量,减轻心脏负荷,有利于肺水肿消除. B降低呼吸中枢对CO₂的敏感性,使呼吸频率减慢,消除窒息感 C镇静作用,消除恐惧感,降低心肌耗氧量. [不良反应] 1.副作用: 眩晕、恶心、便秘、排尿困难. 2.反复应用产生耐受性和成瘾性 3.过量可致急性中毒,出现昏迷,呼吸深度抑制,瞳孔针尖样缩小,尿潴留,严重缺氧和血压下降,呼吸麻痹.除对症治疗外,尚可注射吗啡对抗药纳洛酮. [禁忌症] 1.诊断未明的急性腹痛. 2.分娩和哺乳期止痛. 3.支气管哮喘、肺心病. 4.颅脑损伤所致的颅内压升高者. 可待因 [特点及应用] 镇痛强度约为吗啡的1/12,镇咳作用为其1/4。对呼吸中枢抑制很轻,成瘾性较弱,但久用也可成瘾。为中枢性镇咳药,用于镇咳;也可用于中等度疼痛 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