

药理学考前辅导笔记（三）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\\_ti2020/507/2021\\_2022\\_\\_E8\\_8D\\_AF\\_E7\\_90\\_86\\_E5\\_AD\\_A6\\_E8\\_c23\\_507233.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/507/2021_2022__E8_8D_AF_E7_90_86_E5_AD_A6_E8_c23_507233.htm) 第十一章局部麻醉药(考前辅导)

了解局部麻醉药的药理作用特点。局部麻醉药是一类局部应用于神经末梢或神经干周围的药物，能暂时、完全和可逆性地阻断神经冲动的产生和传导，在意识清醒的条件下，使局部痛觉暂时消失。对各类组织都无损伤性影响。

【药理作用】1. 局麻作用及作用机制局麻药对任何神经都有阻断作用，对任何刺激不再引起除极化。局麻药在较高浓度时也能抑制平滑肌和骨骼肌的活动。局麻药对神经、肌肉的麻醉的顺序是：痛、温觉纤维gt.中枢抑制性神经元gt.植物神经gt.心肌（包括传导纤维）gt.胃肠平滑肌gt.骨骼肌。局麻药作用于神经细胞膜Na通道内侧，抑制Na内流，阻止动作电位的产生和传导。进一步研究发现，局麻药与Na通道内侧受体结合后，引起Na通道蛋白质构象变化，促使Na通道的失活状态闸门关闭，阻滞Na内流，从而产生局麻作用。

2. 吸收作用:局麻药的毒性反应。（1）中枢神经系统:先兴奋后抑制，初期表现为眩晕、烦躁不安、肌肉震颤。进而发展为神志错乱及全身性强直-阵挛性惊厥。最后转入昏迷，呼吸麻痹。中枢神经抑制性神经元对局麻药比较敏感，首先被局麻药所抑制，因此引起脱抑制而出现兴奋现象。局麻药引起的惊厥是边缘系统兴奋灶扩散所致。苯二氮类能加强边缘系统GABA能神经元的抑制作用，有较好的对抗局麻药中毒性惊厥的效果。此时禁用中枢抑制性药物。而中毒昏迷时应着重维持呼吸及循环功能。（2）心血管系统局麻药对之有直

接抑制作用。开始时的血压上升及心率加快（中枢兴奋），后表现为心率减慢、血压下降、传导阻滞直至心搏停止。中毒后常见呼吸先停止，故宜采用人工呼吸抢救。【局部麻醉的方法】表面麻醉：又称粘膜麻醉。用于粘膜表面，借助药物穿透力，使粘膜下的感觉神经末梢麻醉。常用于五官科手术。浸润麻醉：将药物注射于手术部位的皮内、皮下、粘膜下或深部组织中，使其浸润感觉神经末梢，产生局部麻作用。用于表浅小手术。传导麻醉：又称阻滞麻醉。是将药液注射到神经干周围，以阻断神经干的传导，使该神经干所支配的区域产生麻醉。常用于四肢、盆腔、会阴、牙手术。腰椎麻醉：又称脊髓阻滞麻醉，简称腰麻。药液注入脊髓蛛网膜下腔，以阻断脊髓神经根的传导，产生较大范围的麻醉。适用于中下腹、下肢手术。硬膜外麻醉：药液注入硬膜外腔内，沿脊神经根扩散至椎间孔，以麻醉脊神经根。适用于上下腹、下肢手术。但因用量大，要防止误入蛛网膜下腔。[不良反应]除由于品种不同，耐受性差，过敏等外，均与用量相关；常由于超量、吸收快或误注入血液循环以致血药浓度偏高。1. 少见的不良反应有 正铁血蛋白血症，偶见于丙胺卡因等少数几个局麻药； 视力模糊或复视，惊厥或抽搐，寒颤或发抖，眩晕和耳鸣，异常地兴奋烦躁甚至昏迷，不寻常的呕吐、多汗、低血压、心动过缓，多数是血药浓度偏高中毒的先兆； 皮疹或寻麻疹，颜面、口唇或咽喉肿痛等，属于过敏反应；酯类药物远比酰胺类药物为多。2. 注射给药时全身性不良反应可有：头痛或背痛，大小便失禁，性欲减退，肢端麻木尤其是下肢为重，呼吸急促或困难，低血压和心动过缓。3. 牙科局麻中可有迁延持久的口唇麻木、震

颤或浮肿。4. 局麻药液中加入肾上腺素，可出现：头晕或头痛，胸痛，血压升高。[药物相互作用] 1. 局麻药液均属酸性，不得与碱性药液混合在一起；即使同属酸性，因可影响各个局麻药pKa值，以致局麻作用减弱，或起效时间迟延。2. 具有对氨基苯甲酸结构的酯类药与磺胺类药合用相互减效。3. 达克罗宁，与含碘的放射显影药会析出碘。4. 普鲁卡因和利多卡因均能增强琥珀胆碱的肌松作用，合用时后者用量需减少。5. 普鲁卡因静滴，已试于作为全麻的辅助用药。但其能促使吸入和静脉全麻药增效，合用时用量应减少。

【影响局麻药作用的因素】 1. 神经干或神经纤维的粗细粗大的神经干有鞘膜包围，局麻药对它的作用不如对神经末梢，所以传导麻醉所需浓度较高，约为浸润麻醉的2~3倍。粗神经纤维（如运动神经）对局麻药的敏感性不如细神经纤维（如痛觉神经及交感神经） 2. 体液pH局麻药在体内呈非离子型与离子型。非离子型亲脂性高，易穿透细胞膜进入神经细胞发挥局麻作用。体液pH偏高时，非离子型较多，局麻作用增强；反之局麻作用减弱。炎症区域内pH降低，因此局麻药的作用减弱。在切开脓肿手术前，必须在脓肿周围作环形浸润才能奏效。 3. 药物浓度：增加浓度并不能延长局麻维持时间，反加快吸收引起中毒。应将等浓度药物分次注入。 4. 血管收缩药加入微量肾上腺素收缩用药局部的血管，减慢药物吸收，延长局麻作用维持时间，减少吸收中毒。在手指、足趾及阴茎等末梢部位用药时，禁加肾上腺素（引起局部组织坏死）。 [常用局麻药] 1. 普鲁卡因最常用，亲脂性低，不易穿透粘膜，只作注射用药。广泛用于浸润麻醉、传导麻醉、蛛网膜下腔麻醉和硬膜外麻醉和损伤部位的局部封闭。

其代谢产物对氨基苯甲酸（PABA）能对抗磺胺类药物的抗菌作用。偶见过敏反应，用药前宜做皮肤过敏试验。过敏者可用利多卡因代替。

2. 利多卡因作用比普鲁卡因快、强而持久，安全范围较大，能穿透粘膜，可用于各种局麻方法。临床主要用于传导麻醉和硬膜外麻醉。还可用于抗心律失常。

3. 丁卡因又称地卡因，作用及毒性均比普鲁卡因强10倍，亲脂性高，穿透力强，易进入神经，也易被吸收入血。最常用作表面麻醉、腰麻及硬脊膜外腔麻醉，一般不用于浸润麻醉。在血中被胆碱酯酶水解速度较普鲁卡因慢，故作用较持久，约2~3小时。

4. 布比卡因又称麻卡因是常用局麻药中作用维持时间最长的药物，约5~10小时。其局麻作用较利多卡因强4~5倍，安全范围较利多卡因宽，无血管扩张作用。主要用于浸润麻醉、传导麻醉和硬膜外麻醉。

### 中枢神经系统药理概论(考前辅导)

#### 中枢神经系统的递质和受体

已知中枢递质达30余种，现介绍几种重要的递质、受体和功能。

1、乙酰胆碱（ACh）在中枢分布广泛，受体分M及N型，功能与运动、记忆、警觉及内脏活动有关，中枢ACh主要为兴奋性递质，如动物激怒时，脑内ACh释放，睡眠时ACh释放减少。

2、去甲肾上腺素（NA）NA在中枢内分布较集中，主要在下丘脑等处，受体分 $\alpha$ 和 $\beta$ 型，功能与警觉、睡眠、情绪等等调节有关，当中枢NA能神经元活性增高时，表现愉快、激动等效应。

3、多巴胺（DA）DA在脑内分布很不均匀，大部分DA集中分布在纹状体、黑质和苍白球，受体D1及D2型。脑内DA能神经通路有

- 黑质 - 纹状体通路：属于锥体外系，使运动协调。当此通路的功能减弱时引起帕金森病，功能亢进则出现多动症。
- 中脑 - 边缘系统通路：功能与情绪、情感有关

。 中脑 - 皮质通路：功能与精神、理智有关。 结节 - 漏斗通路：主管垂体前叶的内分泌功能。精神分裂症患者的第一条通路第功能失常，并伴有脑内DA受体增多。抗精神分裂症药通过阻断这两条通路的D2受体发挥疗效。阻断黑质 - 纹状体和结节 - 漏斗通路分别引起锥体外系副作用和内分泌方面改变。

4、5 - 羟色胺（5 - HT）在中枢内以松果体含量最多，受体分S1及S2型。功能是维持情绪和情感的稳定，参与体温、睡眠、内分泌等调节。5 - HT的功能以抑制、稳定为主，而NA以兴奋、激动为主。

5、 - 氨基丁酸（GABA）存在于脑内，以黑质、苍白球中含量最高。GABA是中枢抑制性递质，如癫痫患者大脑皮层缺乏GABA可引起惊厥，丙戊酸钠因能抑制GABA降解而对各种癫痫发作有效。

6、内阿片肽为内源性阿片样肽对简称，脑内以纹状体、下丘脑垂体含量最高。阿片（主要有效成分为吗啡）有镇静、催眠、镇咳、抑制呼吸等作用。

7、组胺（H）脑内组胺的分布很不均匀，以下丘脑和网状结构含量较高，受体分H1及H2型。有调节精神活动、降低体温、增加水摄入和引起呕吐等作用，脑内H1受体激动呈现兴奋，H2受体激动呈现抑制，抗组胺药的嗜睡副作用可能与阻断H1受体有关。

8、前列腺素（PG）PG在各脑区分布均匀，已知多种PG都有致热作用，以PGE2致热作用最强。中枢PG合成酶（环氧酶）抑制剂如乙酰水杨酸使PG合成减少而呈现解热作用。

## 二、中枢神经系统药物作用的基本方式

（一）直接作用于受体：激动或阻断受体。

（二）影响递质的传递过程：影响合成、储存、释放、再摄取、代谢及灭活。

（三）影响神经细胞能量代谢及膜稳定性。

## 三、中枢神经系统药物的分类

1、中枢兴奋药。 2

、中枢抑制药：全身麻醉药、镇静催眠药、抗癫痫药、抗震颤麻痹药、抗精神失常药、镇痛药及解热镇痛抗炎药。第十二章 镇静催眠及抗惊厥药 掌握地西泮的药理作用、作用机制、药动学特点、临床应用及不良反应。熟悉其它苯二氮卓类药物的药理作用特点。熟悉巴比妥类药物的药理作用、药动学特点、不良反应及中毒的解救。了解其他镇静催眠药的药理作用特点。

第一节 苯二氮卓类 分类:1、长效类:安定、氯氮卓。2、中效类:硝基安定。3、短效类:甲基三唑氯安定(三唑仑) 安定(Diazepam) [作用与用途] 1、抗焦虑 安定在小于镇静的剂量即可产生明显的抗焦虑作用,是治疗焦虑症的首选药.2、镇静催眠 特点: 不引起麻醉; 毒性小,安全范围大; 不易产生停药后多、,恶梦的反跳现象。用于 麻醉前给药:使病人镇静,减少麻醉药用量; 失眠:现已取代巴比妥成为首选的催眠药,对焦虑性失眠疗效尤佳.3、抗惊厥、抗癫痫、抗惊厥作用强,用于各种惊厥和癫痫,安定静注是治疗癫痫持续状态的首选药.4、中枢性肌松 较大剂量能抑制脊髓多突触反射,用于中枢病变的肌强直及腰肌劳损引起的肌痉挛. [作用机制] 安定与苯二氮卓(BZ)受体结合后,通过增强 $\gamma$ -氨基丁酸(GABA)的抑制作用,为其产生抗焦虑、镇静、催眠、抗惊厥及中枢性肌松等多种药理作用的主要机制所在. [不良反应] 1、常见副作用 嗜睡、乏力等.2、大剂量偶见共济失调、手震颤.3、中毒可见运动失调、肌无力,甚至昏迷和呼吸抑制.4、长期服用有耐受性、成瘾性,但成瘾性轻且发生率较低.5、孕妇(可能致畸胎)、哺乳妇禁用.用药期间禁止饮酒,因乙醇能加强安定的毒性.

第二节 巴比妥类 [分类] 1、长效(慢效)类:巴比妥、苯巴比妥。2、中效类:戊巴比妥、异戊巴比妥。3、短效

类:司可巴比妥。4、超短效类(麻醉):硫喷妥钠 [体内过程] 1、口服,肌注均易吸收. 2、进入脑组织的速度与其脂溶性高低有关:长效类脂溶性低. 麻醉类脂溶性高,故静注硫喷妥钠立即产生麻醉作用,但进入脑内的药物很快再分布到骨骼肌,随后又转入脂肪,故麻醉作用短暂. 3、消除有肝内代谢和肾排泄两种方式. [作用] 随剂量增加,依次出现镇静、催眠、抗惊厥(抗癫痫)、麻醉、麻痹甚至死亡. [作用机制] 主要与抑制脑干网状结构上行激活系统的功能有关.也能促进GABA的抑制作用.但其选择性较低,剂量较大时即普遍抑制中枢神经系统. [用途] 1、镇静催眠 临床已少用. 2、抗惊厥 常用苯巴比妥钠肌注或异戊巴比妥肌注或静注. 3、抗癫痫 仅苯巴比妥钠有效,用于癫痫大发作及癫痫持续状态. 4、麻醉 仅硫喷妥钠用于静脉麻醉及诱导麻醉. [不良反应] 1、后遗效应(宿醉) 服药后次晨有头晕,困倦等症状. 2、反复用药有耐受性 原因是诱导肝药酶,加速自身代谢. 3、成瘾性 长期应用可产生成瘾性,停药后出现戒断症状. 4、急性中毒 表现昏迷,呼吸抑制,血压下降,死于呼吸抑制。中毒处理原则:洗胃;给氧,人工呼吸吸 输液,给升压药及中枢兴奋药.强效利尿或碱化尿液促进药物排泄. 5、严重肺功能不全者禁用,肝功能不全者慎用. "#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](http://www.100test.com)