

# 16 章

## 抗癫痫药和抗惊厥药

**Antiepilepsy and Antieclampsia Drug**

沈阳医学院药理教研室

赵 润 英

# 第一节 抗癫痫药

## 癫痫病临床相关知识

1.概念： 局部神经元异常高频放电+向周围神经元扩散

2.病因： 遗传  
(30%~40%)

3.发作类型  
(表16-1)

4.治疗方法  
(药物、手术、神经调控)

↓  
大脑功能障碍的慢性疾病

突发性  
反复性  
短暂性

运动、感觉功能失调  
意识障碍  
精神失常  
脑电图异常

5.发病机制

- 兴奋性神经递质（谷氨酸）功能增强  
(后膜 $\text{Na}^+$ 、 $\text{Ca}^{2+}$ 通道开放→ $\text{Na}^+$ 、 $\text{Ca}^{2+}$ 内流→神经元去极化→兴奋性增高)
- 异常放电 抑制性神经递质（GABA）功能减弱  
(激活前膜GABA受体→ $\text{Cl}^-$ 内流→神经元超极化→兴奋性降低)

↑  
易产生动作电位

6.抗癫痫药作用机制

- 增强GABA功能
- 降低谷氨酸功能

→ 抑制异常放电  
阻止放电扩散

# 一、常用抗癫痫药

## 卡马西平 (Carbamazepine, 又名酰胺咪嗪)

### 【体内过程特点】

吸收缓慢而不规则、自身为药酶诱导剂。

### 【药理作用和临床应用】

- 1.抗癫痫：广谱。大发作、局限性发作**首选药**。
- 2.治疗中枢疼痛综合征：三叉神经痛（优于苯妥英钠）、舌咽神经痛**首选药**。
- 3.抗躁狂：躁狂症（锂盐无效时）。

### 【作用机制】

- 1.增强 GABA功能
- 2.阻断 $\text{Na}^+$ 通道



抑制神经元异常放电

### 【不良反应】

常见：中枢神经系统症状

少见：骨髓抑制

# 苯妥英钠 (Phenytoin Sodium, 又名大仑丁)

## 【体内过程特点】

吸收慢而不规则、消除速度与血药浓度有关、自身为药酶诱导剂。

## 【药理作用与临床应用】

1. 抗癫痫：大发作、局限性发作的**一线药**（要先用苯巴比妥）。
2. 治疗中枢疼痛综合症：治疗三叉神经痛、舌咽神经痛、坐骨神经痛。
3. 抗心律失常（见第二十二章抗心律失常药）

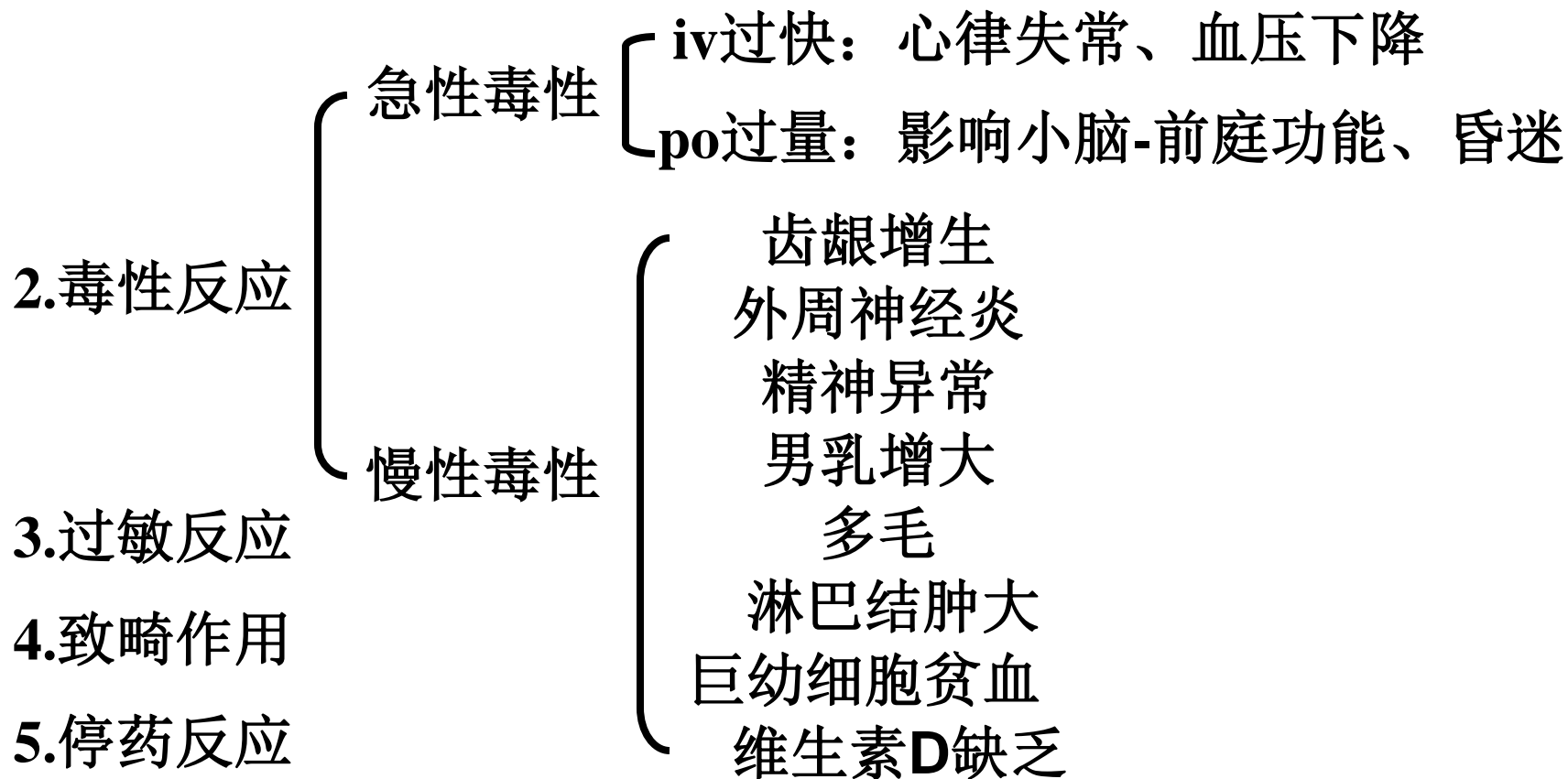
## 【抗癫痫作用机制】

**阻止异常放电向周围神经元扩散**

1. 抑制突触传递的强直后增强（PTP）。
2. 细胞膜稳定作用（含三种作用），即：阻断 $\text{Na}^+$ 、 $\text{Ca}^{2+}$ 通道  
→  $\text{Na}^+$ 、 $\text{Ca}^{2+}$ 内流减少 → 细胞兴奋性降低 → 不易产生动作电位。

## 【不良反应】

1.局部反应： 胃肠刺激



## 【药物相互作用】

1. 本身为肝药酶诱导剂
2. 加速本品代谢的药
3. 促进本品灭活的药
4. 降低本品血药浓度的药
5. 提高本品血药浓度的药

# 苯巴比妥 (Phenobarbital, 又名鲁米那)

## 【药理作用和临床应用】

1. 抗癫痫：主要用于癫痫大发作、持续状态，单纯局限性、精神运动性发作亦有效（中枢抑制作用明显不做首选药）。
2. 镇静催眠：用于安眠有后遗效应

## 【作用机制】

- 
1. 突触后膜：激活GABA受体→  $\text{Cl}^-$ 内流↑→神经元超极化→兴奋性降低
  2. 突触前膜：阻断 $\text{Ca}^{2+}$ 通道→  $\text{Ca}^{2+}$ 内流↓→抑制神经元去极化→兴奋性降低

抑制局部神经元异常放电+阻止向周围神经元扩散

## 【不良反应】

1. 中枢抑制：嗜睡、精神萎靡、共济失调。
2. 血液系统反应：巨幼细胞贫血、白细胞和血小板减少。

# 乙琥胺 (Ethosuximide)

## 【临床应用】

小发作首选药

## 【作用机制】

抑制丘脑神经元T型 $\text{Ca}^{2+}$ 通道有关

## 【不良反应】

1. 胃肠道反应
2. 中枢神经系统反应
3. 血液系统反应：用药期间定期查血象



## 丙戊酸钠 (Sodium Valproate)

### 【临床应用】

1. 广谱，但仅在大发作或小发作无效时应用
2. 大发作合并小发作**首选药**

## 苯二氮卓类(Benzodiazepines,BZ)

### 【临床应用】

1. 地西泮：iv作为癫痫持续状态**首选药**
2. 硝西泮：对小发作、肌阵挛发作、婴儿痉挛有效。
3. 氯硝西泮：广谱抗癫痫

# 氟桂利嗪(Flunarizine)

## 【药理作用与临床应用】

强效Ca<sup>2+</sup>通道阻滞药，安全、有效、不良反应少的广谱抗癫痫。

## 抗癫痫药应用注意事项

1. 根据发作类型选药孕妇禁用
2. 单用：单纯型
3. 联用：混合型单药难奏效
4. 不可突然停药
5. 长期用药检查血象、肝功能

## 第二节 抗惊厥药

### 一、惊厥的概念

多种疾病（小儿高热、子痫、破伤风、癫痫大发作、中枢兴奋药中毒）的症状：全身骨骼肌不自主强烈收缩。

### 二、抗惊厥药分类

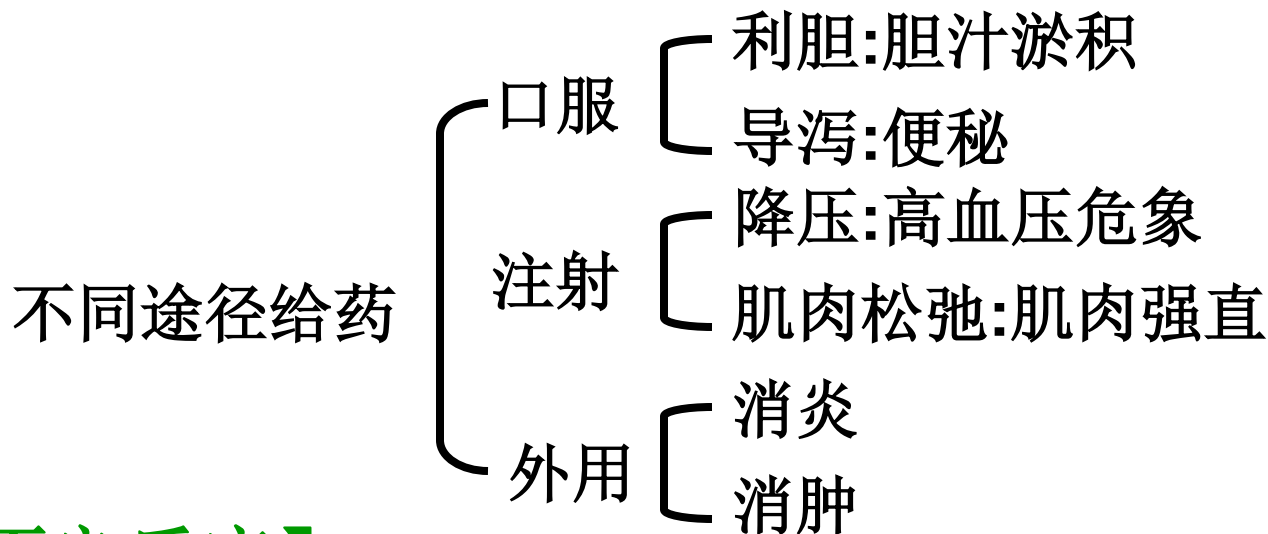
巴比妥类、苯二氮卓类、水合氯醛、硫酸镁

### 三、常用药（硫酸镁）

机制：拮抗 $\text{Ca}^{2+}$ →干扰ACh释放

# 硫酸镁

## 【药理作用和临床应用】



## 【不良反应】

