



安徽中醫藥高等專科學校

2019

安徽省《药物化学》省级精品线下开放课程

Anhui College of Traditional Chinese Medicine | Depart of Pharmacy

安徽中医药高等专科学校 | 药学系

药物化学与药物分析教研室 | 赵茗毅





第二节 抗癫痫药



第二节 抗癫痫药

癫痫是一类慢性、反复性、突然发作性的大脑功能失调疾病。其特征为脑神经元突发性异常高频放电，并向周围扩散。



第二节 抗癫痫药

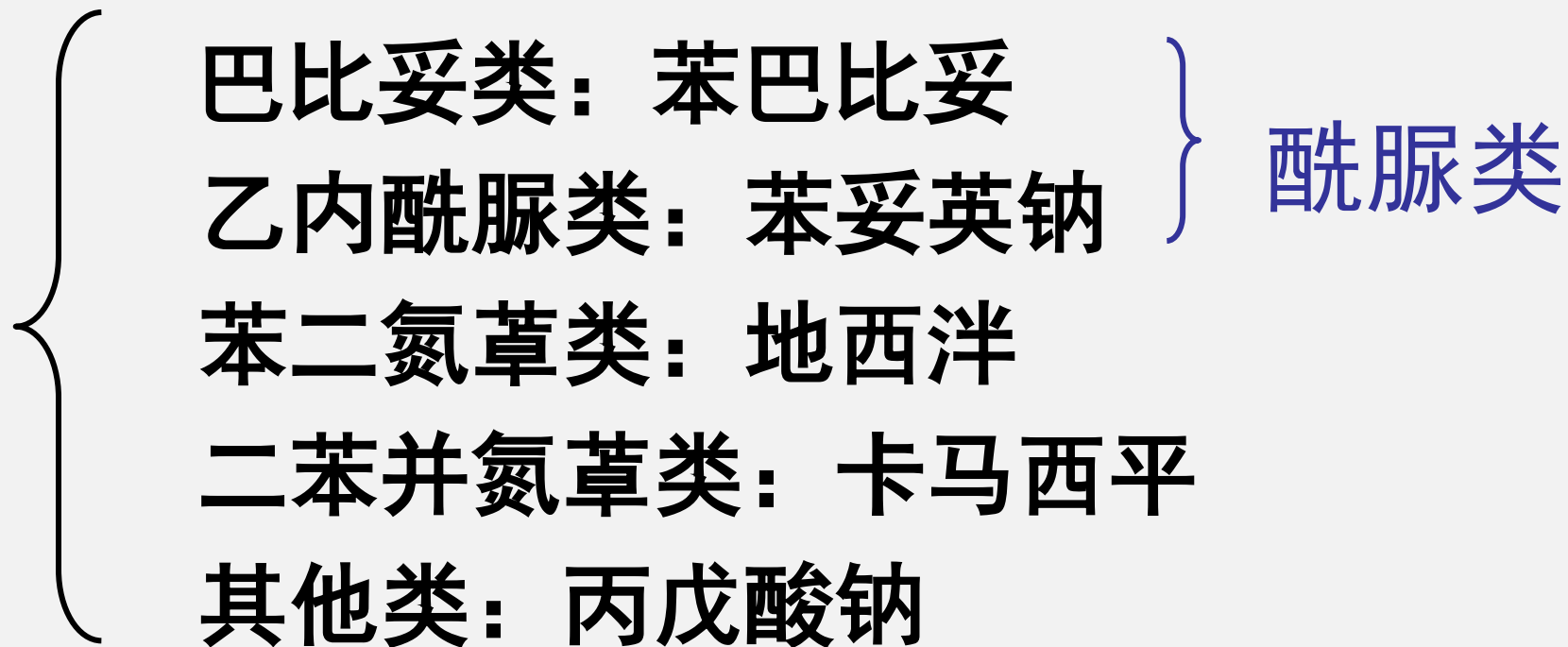


抗癫痫药可抑制大脑神经的兴奋，用于防止和控制癫痫的发作。

第二节 抗癫痫药



❖ 分类——按化学结构



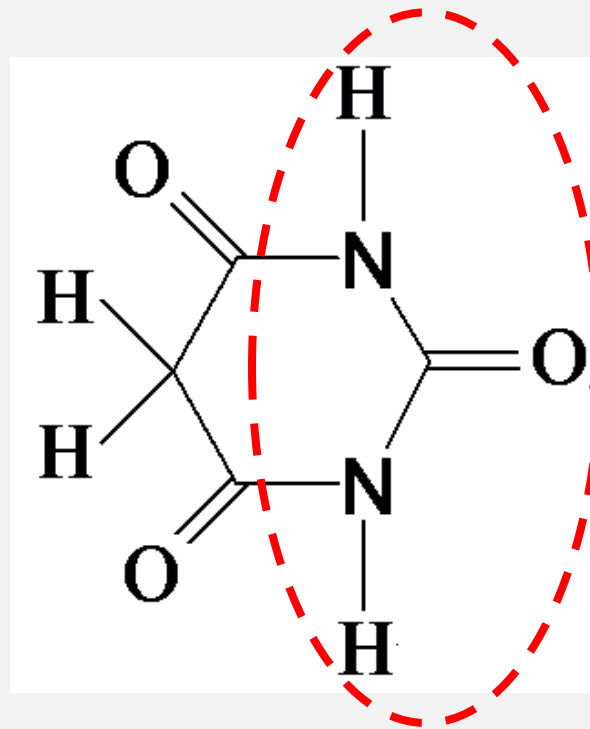


一、酰脲类

(一) 概述

巴比妥类药物

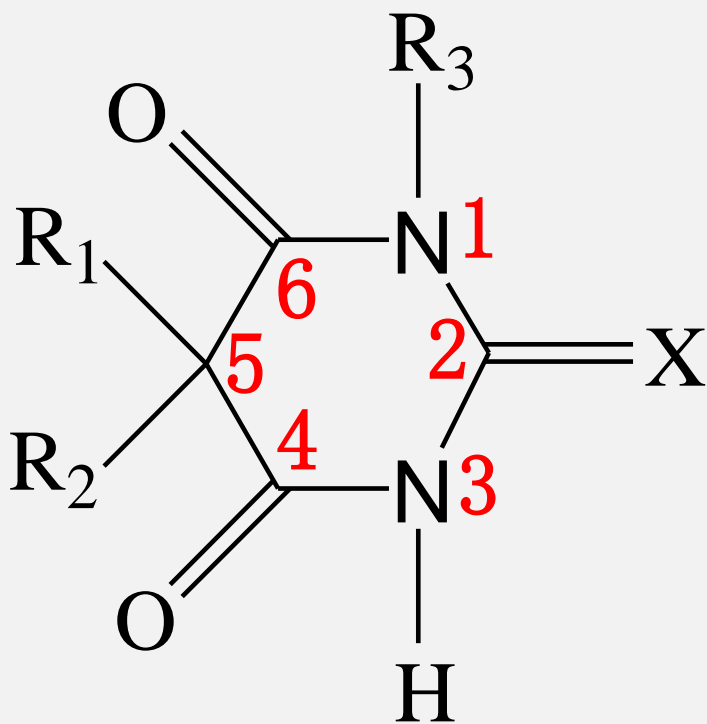
是巴比妥酸（**丙二酰脲**）的衍生物，是较早用于临床的一类镇静催眠药。





(一) 概述

1. 基本结构：



巴比妥酸本身不具有治疗作用，只有C₅上的两个H被烃基取代，才能产生活性。取代基不同，作用强弱、快慢、长短也不同。



(一) 概述

巴比妥类药物分类:

(按作用时间不同分)

长效 (4-12h)

苯巴比妥

中效 (2-8h)

异戊巴比妥

短效 (1-4h)

司可巴比妥

超短效 (0.5-1h)

硫喷妥钠



(一) 概述

2、构效关系：

1、解离度对药效的影响：

**通常药物以分子形式透过细胞膜，
以离子发挥作用，要有合适的解离度。
与C5上取代基数目有关。**



(一) 概述

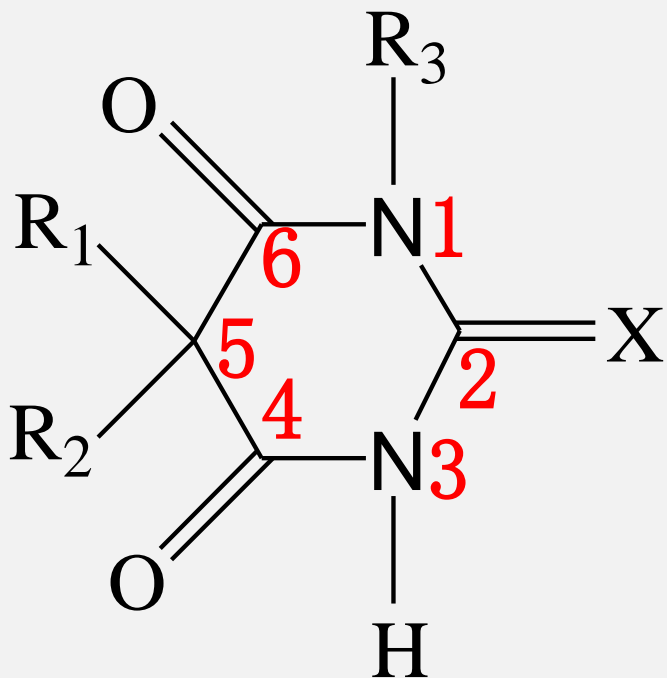
2、脂水分配系数对药效的影响：

适当的脂水分配系数，才有利于药物在体内的转运和分布。中枢神经系统的药物需要透过血脑屏障，因此亲脂性对于巴比妥类药物的镇静催眠作用影响很大。



(一) 概述

2、脂水分配系数对药效的影响：



①主要与C5上取代基有关。
两个取代基碳原子总数在
4~8

②S: 脂溶性增加, 起效快,
时间短

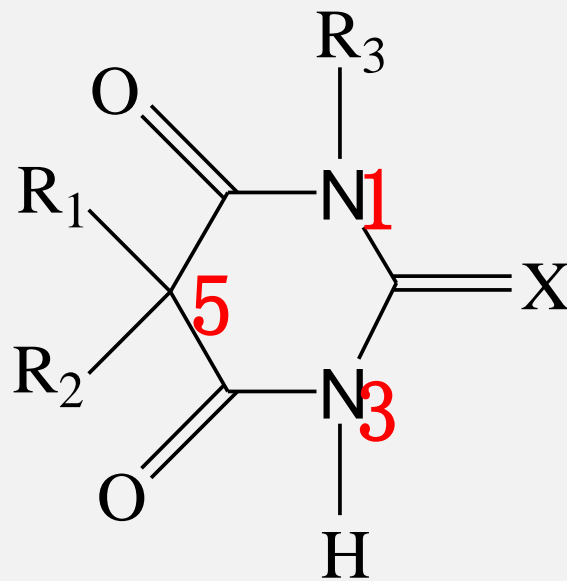
③甲基: 脂溶性增加, 起
效快



(一) 概述

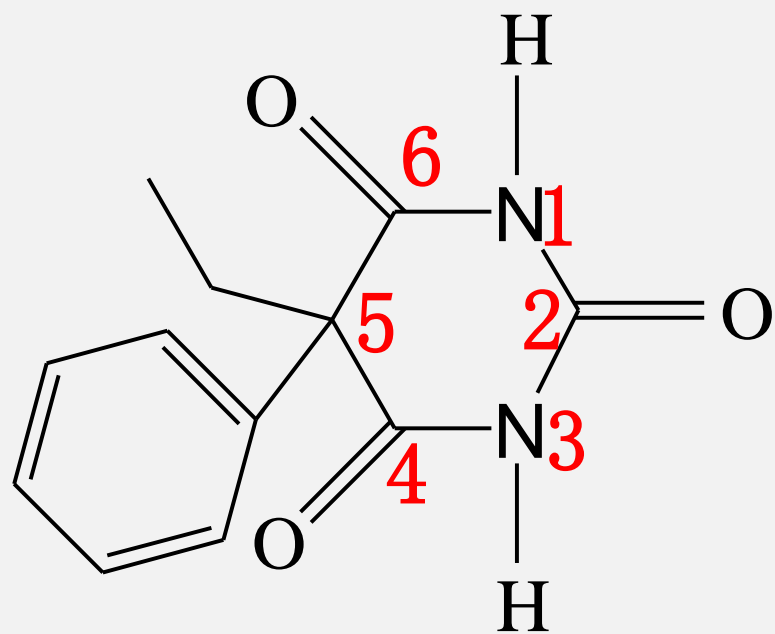
3、在体内的持续时间与药物在体内代谢的难易有关。

巴比妥类药物
的代谢，主要是5
位碳上取代基的氧
化。

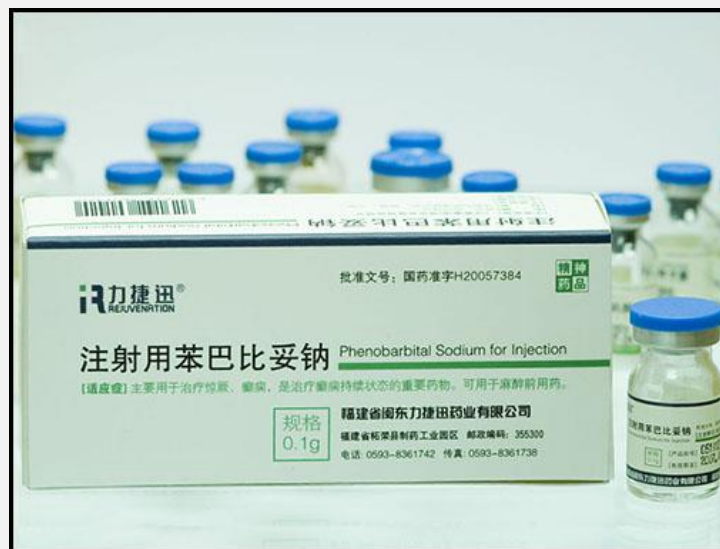


(二) 典型药物

* 苯巴比妥

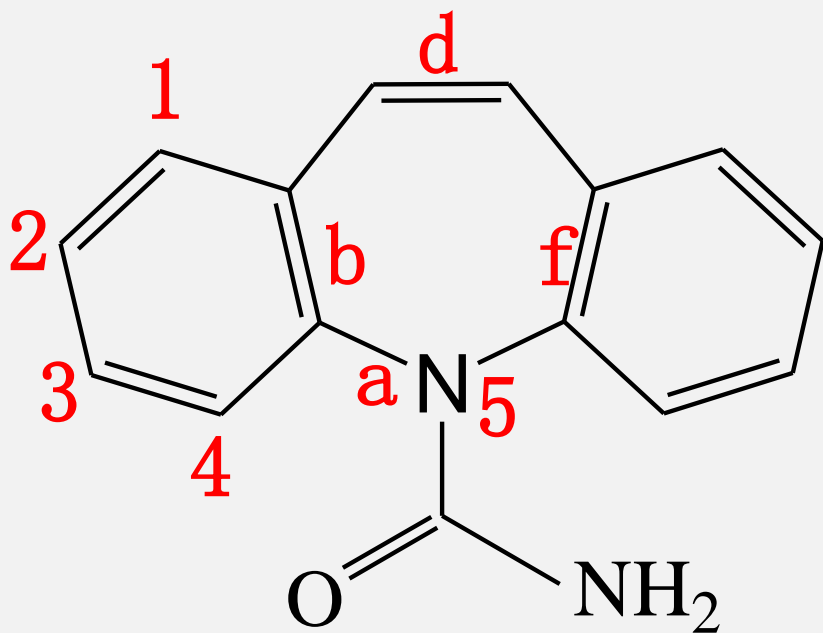


化学名：5-乙基-5-苯基-2, 4, 6
(1H, 3H, 5H) - 嘧啶三酮





二、二苯并氮草类 卡马西平



化学名：5H-二苯并[b, f]氮杂萘-5-甲酰胺



1) 理化性质及稳定性

**几乎不溶于水，易溶于氯仿。
需避光（防聚合、氧化）**

2) 鉴别

与硝酸共热→橙红色

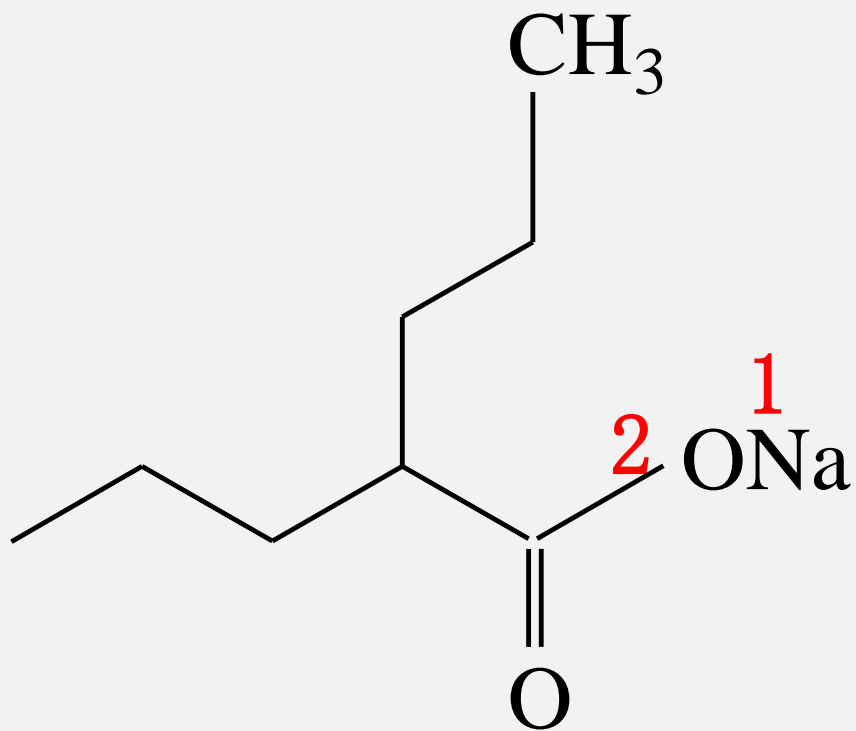
3) 药效

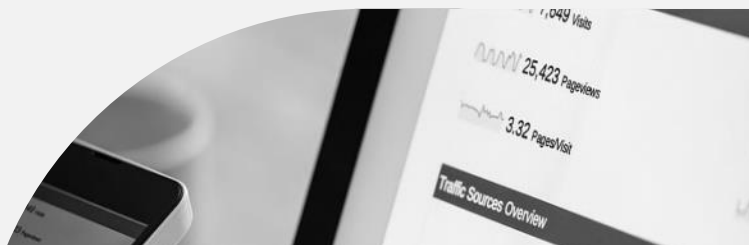
- ①用于癫痫大发作和综合性发作**
- ②抗外周神经痛**



三、其他类

丙戊酸钠





安徽省《药物化学》精品线下开放课程

