



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





第四章

中枢神经系统药物



目录 contents

- 1 镇静催眠药
- 2 抗癫痫药
- 3 抗精神病药
- 4 抗抑郁药
- 5 镇痛药
- 6 神经退行性疾病治疗药



第一节 镇静催眠药



第一节 镇静催眠药

镇静药

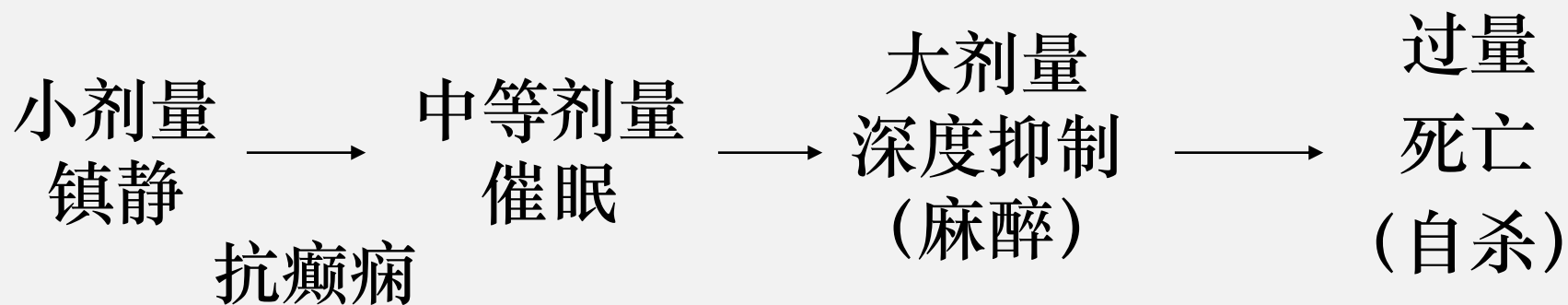
■使服用者处于安静或思睡状态的药物

催眠药

■引起类似正常睡眠状态的药物



第一节 镇静催眠药





第一节 镇静催眠药

❖ 按化学结构分为：

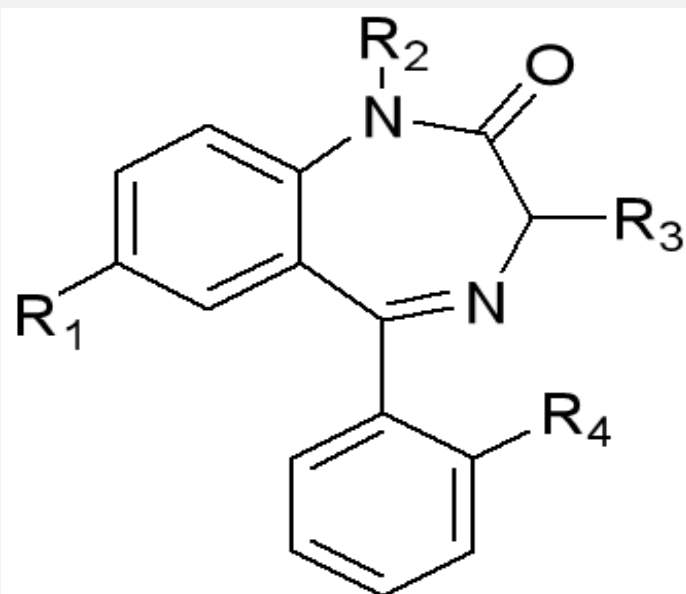
- 苯二氮草类
- 非苯二氮草类





一、苯二氮草类

结构特征为具有苯环和七元亚胺内酰胺环
并合的苯二氮草类母核，其中**1,4-苯二氮杂草**
的镇静催眠药作用最强。



苯二氮草类基本结构



(一) 概述



苯二氮草类药物为20世纪60年代开发的一类镇静催眠药。

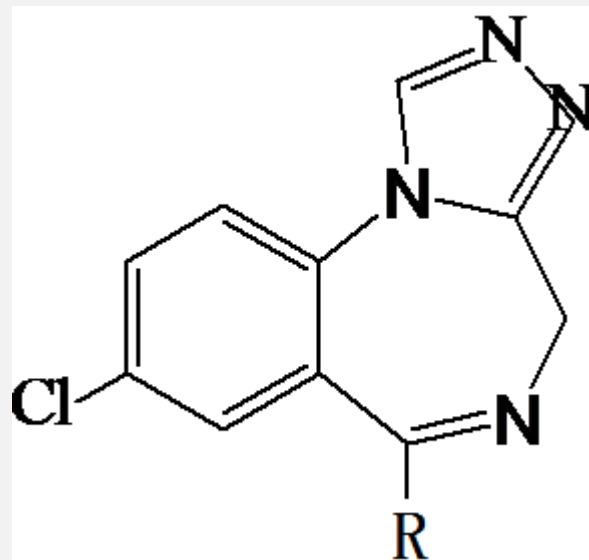
由于此类药物选择性高，毒副作用小，安全，在临床上已成为镇静、催眠、抗焦虑的首选药物。

发展:

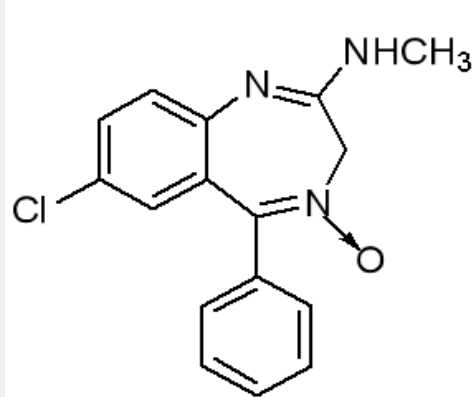
氯氮草: 有成瘾性

地西洋: 强, 不良反应少

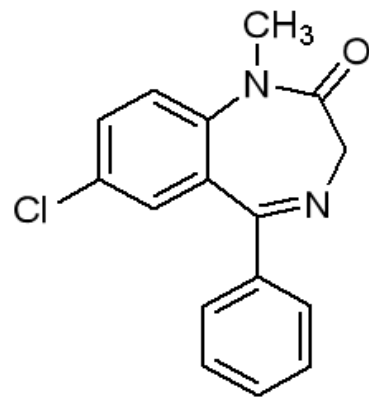
硝西洋、氯硝西洋、三唑仑等



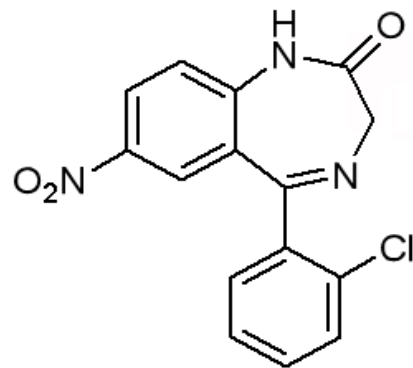
三唑仑比西泮在1,2位多拼合了一个五元环,
更稳定, 易和受体结合, 脂溶性增强, 活性增强。



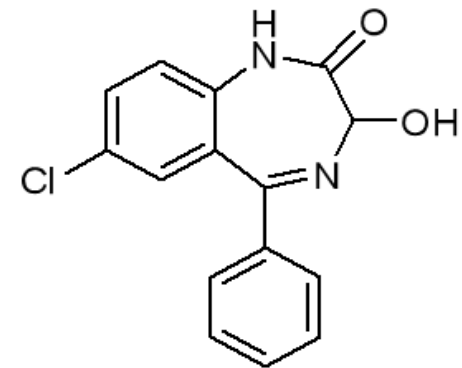
氯氮草



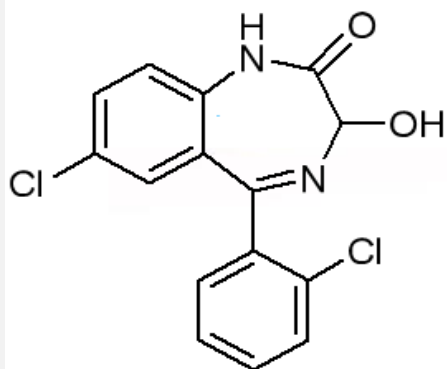
地西洋



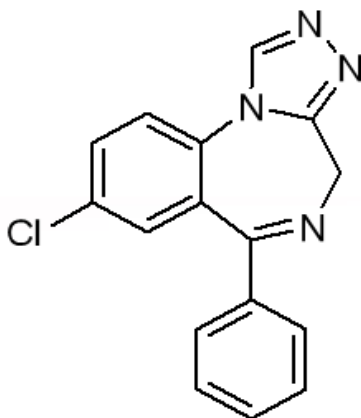
氯硝西洋



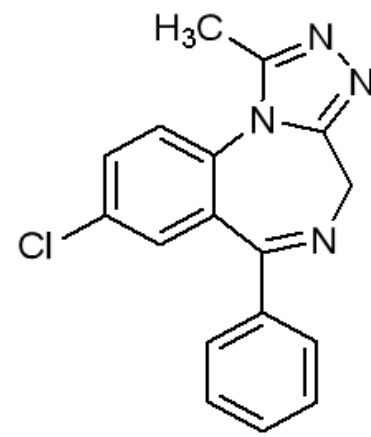
奥沙西洋



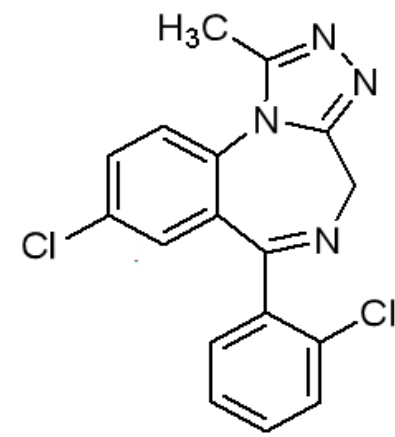
劳拉西洋



艾司唑仑



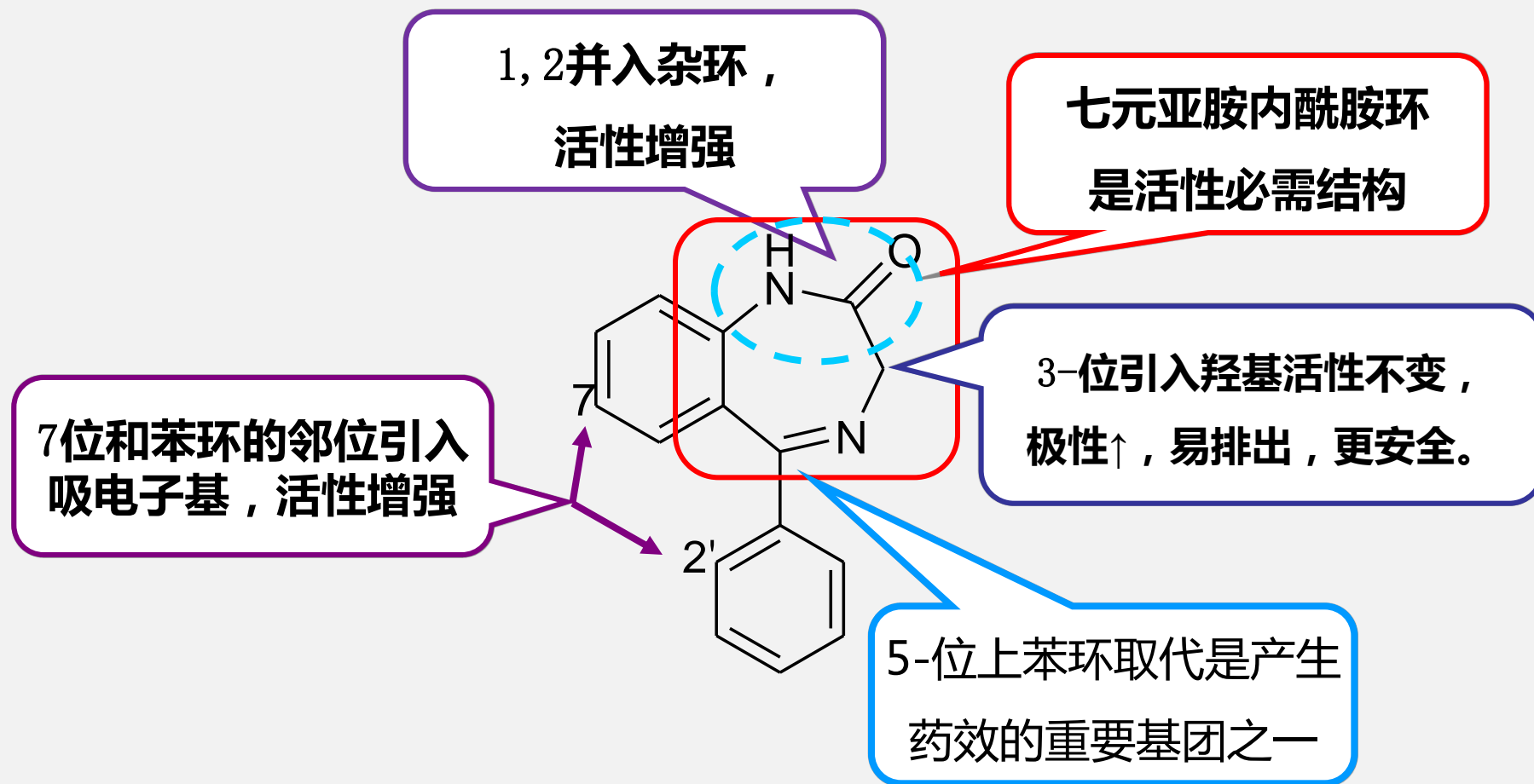
阿普唑仑



三唑仑

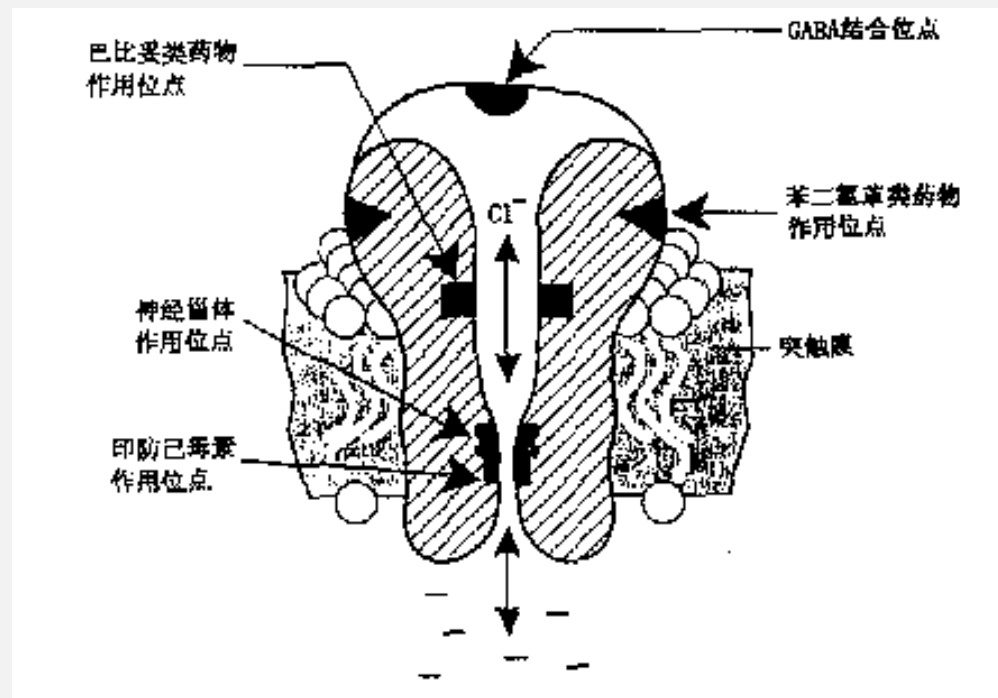


苯二氮草类药物的构效关系:

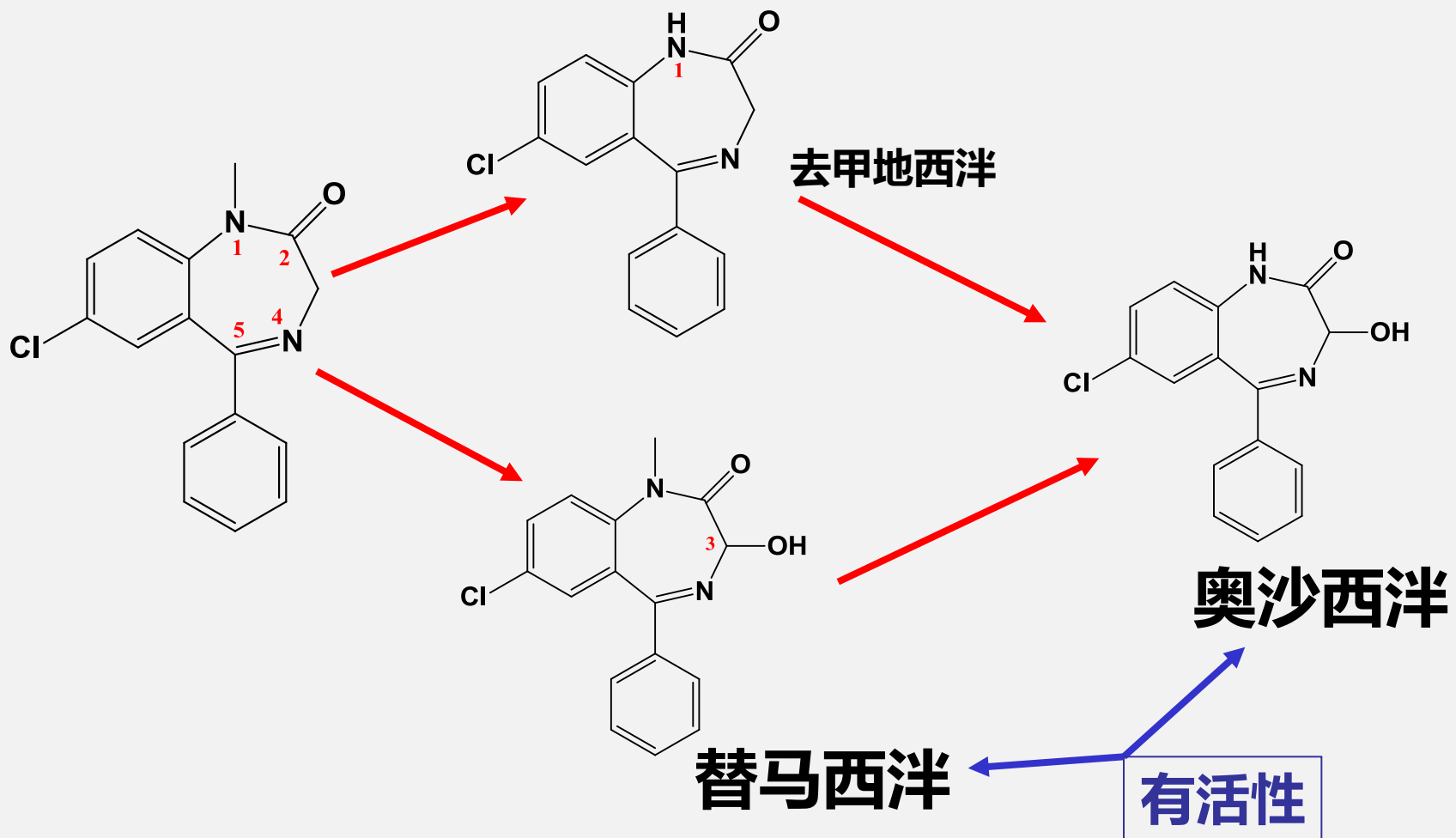


苯二氮草类的作用机制：

与苯二氮草受体结合，主要影响GABA（ γ -氨基丁酸）受体，产生中枢抑制作用。



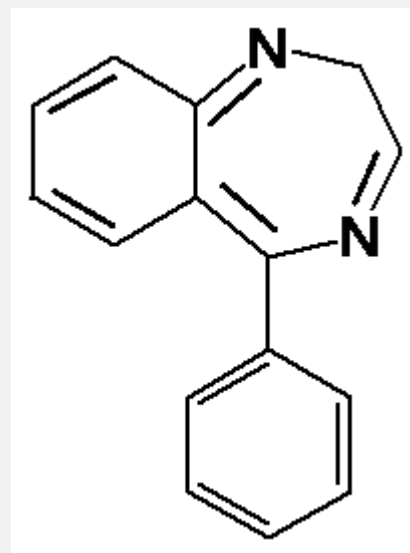
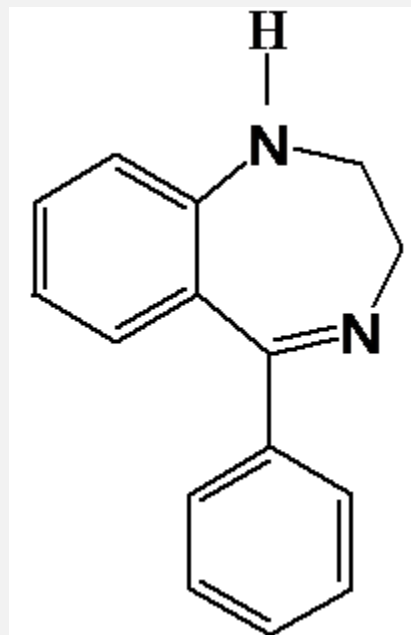
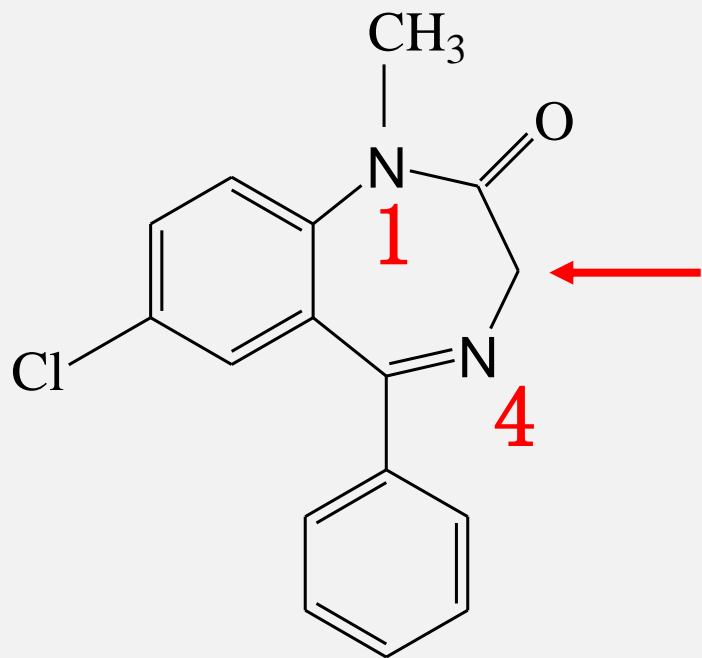
体内代谢





*地西洋 (安定)

地西洋上只有4个双键，除指示的一个H外，还有两个饱和位置，采用加氢来表示。本例中为2位酮基的位置优先用指示氢表示结构特征的位置，其余两个饱和位置1、3-二氢表示。



化学名：**1-甲基-5-苯基-7-氯-1, 3-二氢-2H-1, 4-苯并二氮杂草-2-酮**
指示氢

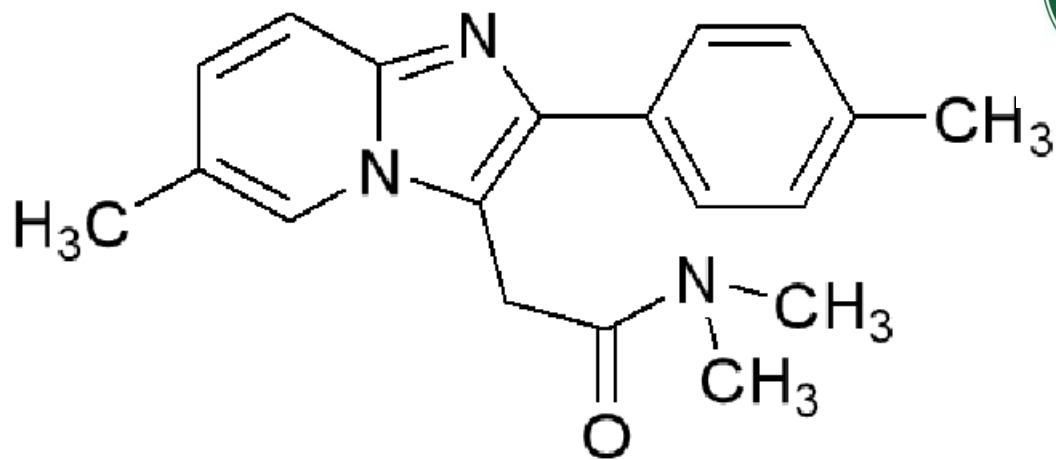




二、非苯二氮草类

- 除苯二氮草类镇静催眠药以外，还有一些其他类型的药物也具有镇静催眠的作用。
- 例如：唑吡坦
佐匹克隆

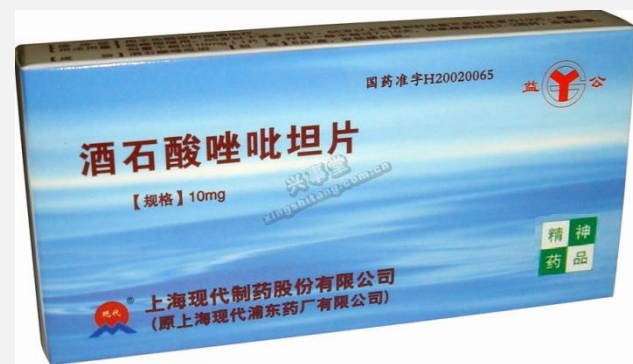
唑吡坦



唑吡坦

用药剂量小，作用时间短，极少产生耐受性和成瘾性。临床用于治疗各种失眠症。无呼吸抑制作用。

无宿醉

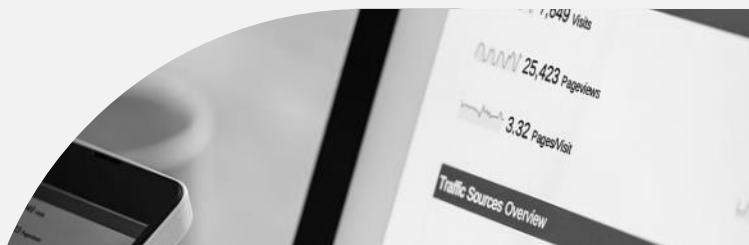


佐匹克隆



1个手性碳，
右旋体活性强。
快、久。





安徽省《药物化学》精品线下开放课程

