

执业药师考前辅导药物化学[2] PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/183/2021_2022__E6_89_A7_E4_B8_9A_E8_8D_AF_E5_c23_183211.htm 第8章 解痉药及肌肉松弛药 第1节 解痉药 解痉药属于抗胆碱药，阻断M—胆碱受体，松弛平滑肌，解除痉挛，主要用于胃、肠、肾绞痛。一、颠茄生物碱类：都有Vitali反应。阿托品： α -(羟甲基)苯乙酸-8-甲基-8氮杂双环[3, 2, 1]-3-辛酯硫酸盐-水合物 性质：1、碱性中易水解(酯键)，微酸中性较稳定，Vitali反应。2、水液呈强碱性，与氯化汞析出黄色沉淀-白色，碱性弱的东莨菪碱无此反应。丁溴东莨菪碱：6,7位氧桥，亲脂性增加，中枢作用加强。Vitali反应，水液溴化物反应，避光。氢溴酸东莨菪碱：避光。镇静药，全麻给药，晕动病、震颤麻痹和狂躁性精神病，感染性休克。氢溴酸山莨菪碱：6位-OH，中枢作用最低。显Vitali反应，紫堇色。总结：中枢作用：东莨菪碱 > 阿托品 > 山莨菪碱 东莨菪碱：东莨菪醇与左旋莨菪酸所成的酯 阿托品：莨菪醇与消旋莨菪酸生成的酯。有不对称碳原子，左旋莨菪碱的外消旋体。二、合成类解痉药 1、苯乙酸类衍生物：溴丙胺太林(普鲁本辛)：对胃肠道有选择性，胃十二指肠溃疡及肠胃道痉挛，妊娠呕吐，多汗 2、二环丙醇胺类化合物 盐酸苯海索(安坦)： α -环己基- α -苯基-1-哌啶丙醇盐酸盐 中枢性抗胆碱药 性质：含氮杂环：三硝基苯酚，碘化铋钾沉淀。抗震颤麻痹、中老年人帕金森病 第二节 肌肉松弛药 一、按作用机制分 1、外周性肌肉松弛药(非去极化型肌松药) 苯磺阿曲库铵 泮库溴铵：甾体结构类，可作外科手术时肌肉松弛。 2、中枢性肌肉松弛药 氯琥珀胆碱：骨骼肌松弛

药，持续短，常用全麻辅药，缓解肌肉痉挛。性质：极溶于水，含酯键，水液不稳定，PH3-3.5水解慢，加热或碱性水解。

二、按来源分：生物碱类(箭毒碱)和合成类(全部) 氯唑沙宗：为口服中枢性肌松药，吸收快，作用持久，毒副作用小。

第九章 抗过敏药和抗溃疡药 第一节 抗过敏药 一、组胺H1受体拮抗剂的化学结构类型 过敏介质：组胺、白三烯、缓激肽

1、乙二胺类 2、哌嗪类 3、氨基醚类：盐酸苯海拉明：2-二苯甲氧基-N，N-二甲基乙胺盐酸盐

1、有醚键：对碱稳定，酸中水解为二苯甲醇 2、对光稳定，曝晒16h或存放3年不变色。杂质二苯甲醇(受光氧化)和二甲基氨基乙醇 3、叔胺结构，类似生物碱沉淀试剂反应。Mandelin、Froehde、Macquis

4、丙胺类：氯苯那敏(扑尔敏)：-(4-氯苯基)-N，N-二甲基-2-吡啶丙胺马来酸盐

1、具有升华性，有特殊晶型 右旋体(S)强于左旋用消旋体 2、叔胺类反应 3、戊烯二醛反应：吡啶环，PH3.5中与溴化氢，吡啶环开环。

5、三环类：盐酸赛庚啶：4-[5H-二苯并[a，d]环庚三烯-5-亚基]-1-甲基哌啶盐酸盐倍半水合物

性质：1、含氮碱性化合物，与生物碱显色试剂反应。2、甲醇溶液滴于纸上风干后紫外照射，显蓝色荧光。无杂原子 应用：抗5-羟色胺及抗胆碱作用(唯一)。

酮替芬：含杂原子S，抗组胺是扑尔敏的10倍，时间长，抗过敏介质释放。治疗、控制哮喘

6、哌啶类 特非那定：几乎无中枢镇静作用的H1受体拮抗剂

7、无嗜睡作用的H1受体拮抗剂：阿司米唑

二、组胺H1受体拮抗剂构效关系：1、两个芳环R和R'不处于同一平面时，具有最大的抗组胺活性。2、几何异构体有立体选择性，显示不同的活性。3、光学异构体也显示不同的活性。

第二节 抗溃疡药 一、H2受体拮抗剂：西咪替丁

：咪唑类 第一个对P450细胞色素氧化酶有抑制 咪唑基、胍基、胍基、硫醚键 盐酸雷尼替丁：-2-咪唑基-- 咪唑类 小火加热产生硫化氢，与醋酸铅生成黑色硫化铅沉淀。法莫替丁：--4-噻唑基-- 噻唑类 高选择，作用强，胃粘膜保护作用 噻唑环、磺酰胺基 二、质子泵抑制剂 奥美拉唑：5-甲氧基-2-[[4-甲氧基-3,5-二甲基-2-吡啶基)甲基]亚磺酰基]-1H-苯并咪唑 性质：1、两性化合物，强酸中分解。含亚砷、吡啶环 2、前药，与H/K-ATP酶结合，抑制胃酸分泌，愈合率高 总结：生物碱沉淀试剂反应：盐酸苯海拉明、马来酸氯苯那敏、盐酸赛庚啶 盐酸苯海拉明：对碱稳定，酸中水解为二苯甲醇 第十章 寄生虫病防治药物 第一节 驱肠虫药 一、哌嗪类 枸橼酸哌嗪(驱蛔灵)：抗胆碱作用，一、麻痹虫体排出体外。光敏感，一、适于驱蛔虫和蛲虫。性质：1、酸性中与硫氰酸铬铵成红色沉淀。2、碳酸氢钠碱性下与铁氰化钾和汞显红色。枸橼酸被高锰酸钾氧化 3、稀盐酸中与亚硝酸钠，有哌嗪小叶状析出。二、咪唑类：盐酸左旋咪唑：抑制肠虫对葡萄糖的摄取。广谱驱虫药，主要驱蛔虫、免疫调节剂。性质：1、微黄色晶状结晶性粉末 2、水液与氢氧化钠共沸，噻唑环开环成红色-变浅。3、含叔胺，与生物碱沉淀试剂沉淀反应。三、嘧啶类：噻嘧啶：抑制胆碱酯酶，使寄生虫的精神传导阻滞，麻痹虫体排出。四、苯咪类：阿苯达唑：[(5-丙硫基)-1H-苯并咪唑-2-基]氨基甲酸甲酯 甲苯达唑：[(5-苯甲酰基)-1H-苯并咪唑-2-基]氨基甲酸甲酯 五、三萜类及酚类 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