

执业药师考前辅导药物化学[1] 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_183212.htm 第一章 麻醉药 第一节 全身麻醉药 1、吸入麻醉药 氟烷：2-溴-2-氯-1,1,1-三氟乙烷 起效、苏醒快、作用弱，全麻及诱导麻醉 性质：1、氧瓶燃 蘸 笙 苑 朐 朐 从 厂 骸 缢 乱 冻 衫 蹲 仙? 2、加入硫酸，沉于底部。 甲氧氟烷浮于硫酸上层。 甲氧氟烷：麻醉作用和肌松作用比氟烷强，诱导期长。 恩氟烷：新型高效吸入麻醉药，麻醉肌松作用强，起效快，临床常用。 异氟烷为异构体 乙醚：氧化后生成过氧化物对呼吸道有刺激作用。 2、静脉麻醉药 盐酸氯胺酮：2-(2-氯苯基)-2-(甲氨基)环己酮盐酸盐 2个旋光异构体，用外消旋体 作用快、短、副作用小，诱导期短。 分离麻醉 羟丁酸钠：作用弱、慢、毒性小。 --OH 1、三氯化铁 红色 2、硝酸铈铵 橙红色 第二节 局部麻醉药 一、对氨基苯甲酸酯类 构效关系：1、苯环上增加其他取代基时，因增加空间位阻酯基水解减慢，局麻作用增强。 2、苯环上氨基的氢以烷基取代，增强局麻作用。 丁卡因 3、改变侧链氨基的取代基，有些作用增强。 布他卡因 4、羧酸中的氧原子若以电子等排体硫原子替代(硫卡因)，脂溶性增大，作用增强。 盐酸普鲁卡因：4-氨基苯甲酸-2-(二乙氨基)乙酯盐酸盐 不宜表面麻醉 性质：1、加氢氧化钠有油状普鲁卡因析出。 干燥稳定，避光 PH=3-3.5最稳定。 2、酯键：水溶液水解失活：对氨基苯甲酸及二乙氨基乙醇，前者氧化变色 3、叔胺结构：碘、苦味酸等呈色 4、芳伯氨反应： 盐酸丁卡因：4-(丁氨基)苯甲酸-2-(二甲氨基)乙酯盐酸盐 作用：用于粘膜麻醉，与普

鲁卡因一起成为应用最广的局麻药。二、酰胺类：盐酸利多卡因：N-(2,6-二甲基苯基)-2-(二乙氨基)-乙酰胺盐酸盐-水合物 性质：酰胺键较酯键稳定，酸碱中均较稳定。作用强，可用于表面麻醉 布比卡因：1-丁基-N-(2,6-二甲苯基)-2-哌啶甲酰胺盐酸盐 长效局麻药，用于浸润麻醉。三、氨基酮类及氨基醚类 第2章 镇静催眠药、抗癫痫药和抗精神失常药 第一节 镇静催眠药 一、巴比妥类构效关系：1、丙二酰脲的衍生物，5位碳原子的总数在6-10，药物有适当的脂溶性，有利于药效发挥。2、引入亲脂基团，如以S代替2位碳上的=O硫代巴比妥，酸性降低，脂溶性增大，起效快、短。3、氮原子上引入甲基，降低解离度，增加脂溶性，属起短效；两个氮上都引入甲基，产生惊厥。苯巴比妥：5-乙基-5-苯基-2,4,6-(1H,3H,5H)嘧啶三酮 检查酸度 长效催眠药 性质：1、水液呈酸性，可溶于碱中成苯巴比妥钠，后者易吸潮水解。故水液临用配制。2、丙二酰脲类：铜盐反应：吡啶-硫酸铜----紫堇色 含S巴比妥----绿色 银盐反应：与硝酸汞、硝酸银生成白色胶状沉淀溶于过量氨试液中 溶于甲醛---硫酸：界面显玫瑰红 硝酸钾---硫酸：显红棕色 苯环取代反应 异戊巴比妥：5-乙基-5-(3-甲基丁基)-2,4,6-(1H,3H,5H)嘧啶三酮 中效催眠药 二、苯并二氮杂类：地西泮(安定)：1-甲基-5-苯基-7-氯-1,3-二氢-2H-1,4-苯并二氮-2-酮 1、水解为1,2位，主要4,5位可逆性开环，代谢途径为去甲基(N-CH₃)，C-3位羟基化 2、溶于稀盐酸，加碘化铋钾，产生橙红色沉淀。奥沙西泮(舒宁)：5-苯基-3-羟基-7-氯-1,3-二氢-2H-1,4-苯并二氮杂-2-酮 酸或碱中加热水解，重氮化反应。为安定活性代谢产物 硝西泮：5-苯基-7-硝基-1,3-二氢-2H-1,4-苯并二氮杂

-2-酮 艾司唑仑(舒乐安定)：6-苯基-8-氯-4H-[1,2,4]-三氮唑-[4,3-a][1,4]-苯并二氮杂 1、1,2位并入三唑环，增加亲和力和代谢稳定，增强药理活性。 2、水解后重氮化反应。加稀硫酸，紫外下显天蓝色荧光。比地西洋强2-4倍 阿普唑仑：1-甲基..... 同上 比地西洋强10倍 溶于稀酸后加硅钨酸试液呈白色沉淀，碘化铋钾呈橙红色沉淀 3、氨基甲酸酯类 甲丙氮酯(眠尔通)：2-甲基-2-丙基-1,3-丙二醇二氨基甲酸酯 弱安定药，中枢肌松和安定作用 第二节 抗癫痫药 苯妥英钠(大伦丁钠)：5,5-二苯基-2,4-咪唑烷二酮钠盐 有“饱和代谢动力学”特点 1、水液酸化后析出游离苯妥英，加硝酸银产生白色沉淀。 2、吡啶-硫酸铜生成蓝色络盐。 3、与二氯化汞生成白色沉淀，不溶于氨试液中。与苯巴比妥区别 卡马西平：5H-二苯并[b,f]氮杂-5-甲酰胺 精神运动性发作最有效 第二节 抗精神失常药(强大的多巴胺受体阻滞剂) 一、吩噻嗪类：10位氮原子与侧链碱性氨基之间的碳链以相隔三个碳原子为宜 盐酸氯丙嗪：N,N-二甲基-2-氯-10H-吩噻嗪-10-丙胺盐酸盐 奋乃静：4-[3-(2-氯吩噻嗪-10-基)-丙基]-1-哌嗪乙醇 吩噻嗪环易氧化，中枢性抑制剂、安定 二、硫杂蒯类 三、丁酰苯类 舒必利：...氨基磺酰基..... 适于精神分裂症及焦虑性神经官能症，也用止吐。 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