

药物化学水杨酸类非甾体抗炎药执业药师考试 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/621/2021_2022__E8_8D_AF_E7_89_A9_E5_8C_96_E5_c23_621515.htm 阿司匹林 (Aspirin) 已在临床应用了100多年，为有效的解热镇痛药，用于治疗伤风、感冒、头痛、神经痛、风湿痛及类风湿痛等。近年来经研究发现阿司匹林为不可逆的环氧合酶抑制剂。阿司匹林还能抑制血小板中血栓素A₂ (TXA₂) 的合成，阿司匹林现已用于心血管系统疾病的预防和治疗。长期服用阿司匹林有时可导致胃肠道出血，这是由于抑制了前列腺素的合成，致使胃粘膜失去了前列腺素对它的保护作用，造成胃部血流减少，缺血而引起溃疡。另外阿司匹林及水解产物水杨酸酸性较强对胃粘膜有刺激性，甚至引起胃出血。因此，对阿司匹林进行一系列结构修饰，利用水杨酸分子中的活性功能基羧基将其制成盐、酰胺、酯类以降低羧酸对胃肠道的刺激性。如在临床上应用的有乙酰水杨酸铝 (Aluminumacetylsalicylate)，乙酰水杨酸赖氨酸盐赖氨匹林 (Aspirin-Lysine)，阿司匹林精氨酸盐 (Aspirin-Arginine)，双水杨酯 (Salsalate)，贝诺酯 (Benorilate) 等。

一、阿司匹林 (Aspirin) 化学名：2-乙酰氧基苯甲酸，又名乙酰水杨酸 合成：以水杨酸为原料，在硫酸催化下用醋酐乙酰化制得。 性质：1.阿司匹林为白色结晶或结晶性粉末；无臭或微带醋酸臭；味微酸；溶于乙醇、氯仿、乙醚，微溶于水，其水溶液显酸性。2.稳定性：阿司匹林在干燥空气中稳定，遇湿气时分子中的酯键易被水解，生成水杨酸和醋酸。因此阿司匹林应置于密闭容器中于干燥处保存。3.阿司匹林分子中有羧基，可溶于氢氧化钠或碳酸

钠溶液中，并同时被水解生成水杨酸钠和醋酸钠，加热时水解更快，酸化后即析出白色水杨酸沉淀，并发生醋酸的臭味。

4.阿司匹林分子中无游离酚羟基，与三氯化铁无颜色反应；当将阿司匹林加水煮沸后即被水解，生成的水杨酸与三氯化铁反应，呈紫堇色。

5.由于合成阿司匹林时乙酰化反应不完全，或在阿司匹林贮存时保管不当，成品中含有过多的水杨酸杂质，不仅对人体有毒性，且易被氧化生成一系列醌型有色物质，中国药典规定检查游离水杨酸，采用与硫酸铁反应产生紫色进行检查。

6.阿司匹林结构中含羧基，为弱酸性药物，在酸性条件下不易解离，口服后易被吸收。吸收后很快被酯酶水解生成水杨酸和醋酸，水杨酸具有解热镇痛作用为主要活性成分。

用途：用于发热、头痛、神经痛、风湿热、风湿性和类风湿性关节炎等，还用于心肌梗死、动脉血栓等的预防和治疗。

二、贝诺酯（Benorilate）化学名：4-羟基乙酰苯胺乙酰水杨酸酯，又名苯乐来。阿司匹林（乙酰水杨酸）及对乙酰氨基酚均具有解热镇痛作用，阿司匹林为酸性药物，对胃粘膜有刺激作用。为减小其副作用，使其与对乙酰氨基酚成酯，制成苯乐来。苯乐来为前体药物，在体内被水解为阿司匹林（乙酰水杨酸）及对乙酰氨基酚发挥药效，减小了副作用。

更多信息请访问：执业药师网校 百考试题论坛 百考试题在线考试系统 百考试题执业药师加入收藏 特别推荐：2009年药师资格考试报名时间汇总 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