

药物化学芳基烷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\\_621519.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/621/2021_2022__E8_8D_AF_E7_89_A9_E5_8C_96_E5_c23_621519.htm) 包括芳基乙酸类和芳基丙酸类。

一、芳基乙酸类：5-羟色胺（3-（-羟基乙基）-5-羟基吲哚）是一种炎症介质。对吲哚乙酸衍生物进行研究，发现了吲哚乙酸类非甾体抗炎药吲哚美辛（Indomethacin）具有良好的抗炎活性，但常有胃肠道等副反应。对吲哚美辛进行结构改造，将吲哚环上的-N=用其电子等排体-CH=取代，得到茚衍生物，找到抗炎药舒林酸（Sulindac），副作用小于吲哚美辛。临床上常用的还有苯乙酸衍生物双氯芬酸钠（DiclofenacSodium），依托度酸（Etodolac）与其他多数非甾体抗炎药相比，对COX-2有更大的选择性（COX2：COX-1活性比约为10），胃肠道副作用小。芬布芬（Fenbufen）具有羧基结构，为前体药物，在体内生成联苯乙酸发挥药效。

1.吲哚美辛（Indomethacin）化学名：1-（4-氯苯甲酰基）-5-甲氧基-2-甲基-1H-吲哚3-乙酸。又名消炎痛 性质：（1）吲哚美辛为类白色或微黄色结晶性粉末，室温下在空气中稳定。结构中含酰胺键，其水溶液在pH2-8时较稳定，遇强酸，强碱易被水解，生成对氯苯甲酸和5-甲氧基-2-甲基-1H-吲哚3-乙酸，其分解产物可进一步氧化成有色物质。吲哚美辛遇光也会逐渐分解，应避光保存。（2）吲哚美辛溶于稀氢氧化钠液中，加重铬酸钾溶液加热至沸，酰胺键被水解，再加硫酸加热则显紫色。吲哚美辛溶于稀氢氧化钠液中，加亚硝酸钠溶液，加热至沸后放冷，加盐酸显绿色，放置后渐变黄色。用途：吲哚美辛为芳基乙酸类非甾体抗炎药。用于治疗风

湿性关节炎等。2.舒林酸 (Sulindac) 舒林酸为前药，体外无活性，在体内被代谢为甲硫化物发挥药效。副作用比吲哚美辛小。3.双氯芬酸钠 (Diclofenac Sodium) 化学名：2-[(2,6-二氯苯基)氨基]-苯乙酸钠，又名双氯灭痛。双氯芬酸钠为苯乙酸衍生物，结构中有氯原子，加碳酸钠炽灼至炭化，进行有机破坏后，加水煮沸过滤，滤液显氯化物鉴别反应。双氯芬酸钠为强环氧合酶抑制剂，具有消炎、解热镇痛作用。

二、芳基丙酸类 在芳基乙酸的 碳原子上引入甲基，为芳基丙酸类。引入甲基可增强消炎镇痛作用并减小副作用。例如布洛芬 (Ibuprofen)、萘普生 (Naproxen)、酮洛芬 (Ketoprofen)、非诺洛芬 (Fenoprofen)、氟比洛芬 (Flurbiprofen) 等。芳基丙酸类药物分子结构含有一个手性碳原子，存在一对光学异构体，一般，S(+) 异构体的活性强于R(-) 异构体。

1.布洛芬 (Ibuprofen) 化学名：2-(4-异丁基苯基)丙酸，又名异丁苯丙酸 性质：1) .布洛芬为白色结晶性粉末，几乎不溶于水，分子结构中有羧基，易溶于氢氧化钠或碳酸钠试液。2) .布洛芬分子结构含有一个手性碳原子，存在一对光学异构体，S(+) 异构体的活性强于R(-) 异构体。在体内代谢过程中，部分R(-) 异构体转变成S(+) 异构体。供药用为其外消旋体。用途：芳基丙酸类非甾体抗炎药。用于治疗风湿性关节炎、骨关节炎等。

2.萘普生 (Naproxen) 化学名：(S)-6-甲氧基-2-萘乙酸，性质：萘普生为萘丙酸衍生物，分子结构含有一个手性碳原子，存在一对光学异构体，以其S(+) 异构体供药用。遇光可慢慢变色，应避光保存。用途：萘普生为非选择性环氧合酶抑制剂。用于治疗风湿性关节炎、骨关节炎等。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](http://www.100test.com)