

2010年西药师药物化学辅导：药物化学镇痛药（2）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\\_ti2020/645/2021\\_2022\\_2010\\_E5\\_B9\\_B4\\_E8\\_A5\\_BF\\_c23\\_645779.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/645/2021_2022_2010_E5_B9_B4_E8_A5_BF_c23_645779.htm)

三、合成镇痛药对吗啡的结构进行改造发展了合成镇痛药。合成镇痛药按化学结构类型可分为：吗啡喃类，苯吗喃类，哌啶类，苯基丙胺类（氨基酮类），氨基四氢萘类等。（一）吗啡喃类百考试题 - 全国最大教育类网站(100test.com) 吗啡喃类合成镇痛药也称吗啡烃类，吗啡化学结构中去掉4, 5-醚键，3和17位为氢，7、8位双键氢化，称为吗啡喃，无镇痛活性。17-甲基吗啡喃-3-醇酒石酸盐的左旋体称为酒石酸左啡诺（Levorphanol Tartrate）镇痛作用为Morphine的4倍，为 $\mu$ 受体激动剂。17-（环丁烷甲基）-吗啡喃-3, 14-二醇酒石酸盐称为酒石酸布托啡烷

（Butorphanol Tartrate），为 $\mu$ 受体拮抗剂、 $\kappa$ 受体激动剂，这种混合的激动-拮抗剂（Mixed Agonist-Antagonists）用作镇痛药一般成瘾性小。（二）苯吗喃类 苯吗喃类也称苯并吗啡烷类。此类药中用于临床的喷他佐辛（Pentazocine），又名镇痛新，为混合的激动-拮抗剂，它是 $\kappa$ 受体激动剂、 $\mu$ 受体弱拮抗剂，镇痛作用弱于吗啡（1/6），成瘾性小。非那佐辛（Phenazocine）为 $\mu$ 受体激动剂，镇痛作用为吗啡的10倍。

赛克洛斯（Cyclocine）又名氟痛新，镇痛作用强于喷他佐辛。（三）哌啶类 哌啶类合成镇痛药又可分为4-苯基哌啶类（例如哌替啶）和4-苯胺基哌啶类（例如芬太尼）。1. 盐酸哌替啶（Pethidine Hydrochloride）来源：www.examda.com 化学名：1-甲基-4-苯基-4-哌啶甲酸乙酯盐酸盐。又名度冷丁

（Dolantin）；盐酸哌啶（Meperidine Hydrochloride）。化学

结构可看作吗啡A、D环类似物，虽为酯类药物，但由于4-苯基的空间位阻效应，水溶液短时间煮沸不致水解。哌替啶为 $\mu$ 激动剂，镇痛作用弱于吗啡（1/10），维持时间短。2. 枸橼酸芬太尼（Fentanyl Citrate）化学名：N-苯基-N-[1-（2-苯乙基）-4-哌啶基]丙酰胺枸橼酸盐。为 $\mu$ 激动剂。镇痛作用强于吗啡75~100倍，但持续时间短，临床用于镇痛和辅助麻醉。在Fentanyl结构中哌啶环4位导入含碳或含氧基团，例如阿芬太尼（Alfentanil），舒芬太尼（Sufentanil）等镇痛作用强，持续时间短，临床用于辅助麻醉。（四）苯基丙胺类（氨基酮类）盐酸美沙酮（Methadone Hydrochloride）来源

：[www.examda.com](http://www.examda.com) 化学名：6-二甲氨基-4，4-二苯基-3-庚酮盐酸盐 美沙酮为 $\mu$ 激动剂，临床用其外消旋体，但仅左旋体有效，镇痛作用与吗啡相当，可口服，在肝脏被代谢，其中间代谢物美沙醇、去甲美沙醇和二去甲美沙醇为活性代谢物，半衰期比Methadone长，是美沙酮镇痛作用时间较吗啡长的原因。美沙酮耐受性、成瘾性发生较慢，戒断症状略轻，也用作戒毒药。（五）氨基四氢萘类 地佐辛（Dezocine）属氨基四氢萘类，化学结构为吗啡A、B环类似物，具有激动-拮抗双重作用。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 相关推荐：2010年西药师药物化学辅导：药物化学镇痛药（1）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)