

2011年药物化学辅导：盐酸普鲁卡因 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/647/2021_2022_2011_E5_B9_B4_E8_8D_AF_c23_647124.htm 在Procaine的苯环上以其他取代基取代时，可因空间位阻而使酯基水解减慢，因而使局部麻醉作用增强！Procaine的发现及酯类局麻药的发展过程，提供了从剖析天然产物分子结构进行药物化学研究的一个经典例证。对可卡因的结构改造中发现：苯甲酸酯在Cocaine的局部麻醉作用中占有重要地位。合成了一系列氨基苯甲酸酰胺酯和氨代烷基酯，最终发现了Procaine。Procaine易水解失效，为了克服这一缺点，提高酯基的稳定性，对苯环、酯键、侧链进行改造获得一系列酯类局麻药。在Procaine的苯环上以其他取代基取代时，可因空间位阻而使酯基水解减慢，因而使局部麻醉作用增强，如氯普鲁卡因的局麻作用比Procaine强2倍 毒性小约1/3。苯环上的氨基引入烷基，可增强局部麻醉作用，如丁卡因的局部麻醉作用比普鲁卡因强10倍。在Procaine侧链上引入甲基，因空间位阻作用使酯键不易水解，故使麻醉作用延长，如海克卡因和美普卡因等。特别推荐：[#0000ff>2011年执业药师考试报名时间和报名条件](#) [#0000ff>2011年执业药师考试大纲](#) 更多信息请访问：[#0000ff>2011执业药师辅导精品班](#) 相关链接：[#0000ff>2011年药物化学辅导：糖和苷的鉴别反应](#) [#0000ff>2011年药物化学辅导：树脂类](#) 欢迎进入 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