



高职高专“十三五”规划教材

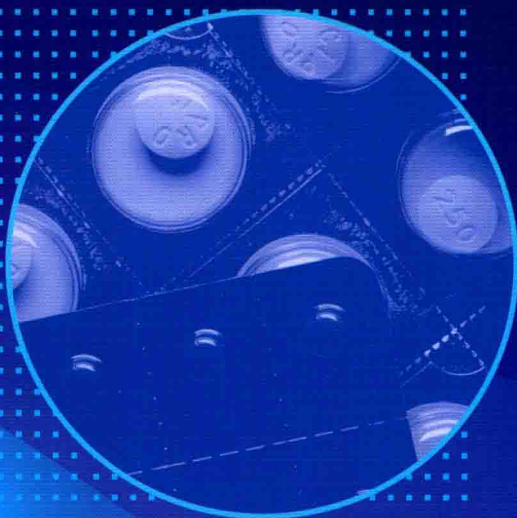
药物化学

杨炳川 鱼江 主编

崔丽京 赵艳霞 副主编



YAOWU HUAXUE



化学工业出版社



高职高专“十三五”规划教材

药物化学

杨炳川 鱼江 主编

崔丽京 赵艳霞 副主编



化学工业出版社

· 北京 ·

本书包括理论和实训两个部分。理论部分分为十六章,以药物的化学结构为线索,重点阐述典型药物名称、化学结构、理化性质、临床用途等内容,简明扼要地介绍各种药物的发展过程、结构类型、重要药物的构效关系、体内代谢等。通过增加知识链接、案例分析等小贴士提升教学内容的知识性和趣味性,以调动广大学生和相关技术人员的学习兴趣。课后检测题型和内容紧扣 2015 年版《中华人民共和国药典》和《全国执业药师考试大纲》进行编写。实训部分含药物化学实训基本知识、技能,各类药物性质、鉴别以及稳定性和药物的合成。主要目的是巩固理论知识和培养学生的动手能力,各个学校可依据具体情况选用。

本书可供药学、药品生产技术、药品质量与安全、药品经营与管理等专业及相关专业的学生选用,也可供相关技术人员学习参考。

图书在版编目(CIP)数据

药物化学/杨炳川,鱼江主编. —北京:化学工业出版社, 2017. 6

ISBN 978-7-122-29541-5

I. ①药… II. ①杨…②鱼… III. ①药物化学 *
IV. ①R914

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2017) 第 087912 号

责任编辑:蔡洪伟 于 卉

文字编辑:林 媛

责任校对:宋 夏

装帧设计:王晓宇

出版发行:化学工业出版社(北京市东城区青年湖南街 13 号 邮政编码 100011)

印 刷:三河市延风印装有限公司

装 订:三河市宇新装订厂

787mm×1092mm 1/16 印张 18 字数 474 千字 2017 年 9 月北京第 1 版第 1 次印刷

购书咨询:010-64518888(传真:010-64519686) 售后服务:010-64518899

网 址: <http://www.cip.com.cn>

凡购买本书,如有缺损质量问题,本社销售中心负责调换。

定 价: 43.00 元

版权所有 违者必究

编写人员名单

主 编 杨炳川 鱼 江

副 主 编 崔丽京 赵艳霞

编写人员 (以姓氏笔画为序)

吴 蔚 武汉职业技术学院

赵艳霞 武汉职业技术学院

崔丽京 广东食品药品职业学院

鱼 江 乐山职业技术学院

杨炳川 重庆三峡医药高等专科学校

前言

本书是在相关医学、药学类专业教学指导委员会专家和部分高职高专示范院校专家的指导下,以工作过程为导向编写的全国高等医药卫生类职业教育高端技能型人才培养规划教材之一,供药学、药品生产技术、药品质量与安全、药品经营与管理、药品服务与管理等专业使用。

本书充分体现新教学日历的特色,着重强调以就业为导向、以能力为本位、以素质建设为中心的原则,体现教材基本知识、基本理论、基本实践技能及科学性、实用性要求,教材特色鲜明,主要体现在如下几点:

- (1) 紧扣教学日历和课程标准,科学、有序,具有鲜明的高等卫生职业教育特色。
- (2) 凸显“校企(院)结合”的人才培养模式。
- (3) 适合高等卫生职业院校教学实际,既有一定的理论知识,又重点强化实践能力。
- (4) 全书紧扣执业资格考试和实际工作岗位需求。

药物化学是药学类专业的主要专业基础课程之一,是化学课程与药物分析、药剂学、临床药学等应用学科之间的桥梁。学习药物化学对全面掌握和了解药学类专业有承前启后的重要作用。

本书包括理论和实训两个部分。理论部分分为十六章,以药物的化学结构为线索,重点阐述典型药物名称、化学结构、理化性质、临床用途等内容,简明扼要地介绍各种药物的发展过程、结构类型、重要药物的构效关系、体内代谢等。通过增加知识链接、案例分析等小贴士提升教学内容的知识性和趣味性,以调动广大学生和相关技术人员的学习兴趣。课后检测题型和内容紧扣《全国执业药师考试大纲》和2015年版《中华人民共和国药典》进行编写。实训部分含药物化学实训基本知识、技能,各类药物性质、鉴别以及稳定性和药物的合成。主要目的是巩固理论知识和培养学生的动手能力,各个学校可依据具体情况选用。

本书按照药理作用和药物作用系统进行章节安排,具体章节依照化学结构分类。依据《中华人民共和国药典》(2015年版二部)和《全国执业药师考试大纲》选择典型药物。在内容安排上,涵盖药学类职业资格证书考试的要求,适应高职教育的“双证书”教学的需要。

本书的编写得到了各编者所在院校的大力支持与帮助,在此表示衷心的感谢。

本书虽经过反复核对,但难免有不当及疏漏之处,恳请广大读者指正,以便今后改进及完善。

编者
2017年1月

目录

理论部分

第一章 绪论	1
一、药物化学的研究内容和任务	1
二、药物化学的发展简史	2
三、药物名称	3
四、药物化学学习方法	4
同步测试	5
第二章 麻醉药	6
第一节 全身麻醉药	6
一、药物概述	6
二、典型药物	7
第二节 局部麻醉药	8
一、药物概述	8
二、典型药物	9
同步测试	11
第三章 镇静催眠药、抗癫痫药及抗精神失常药	13
第一节 镇静催眠药	13
一、巴比妥类药物	13
二、苯二氮草类药	18
三、咪唑并嘧啶类	21
第二节 抗癫痫药	22
一、酞脲类药物	22
二、苯二氮草类	24
三、二苯并氮杂草类药物	25
四、GABA 衍生物	26
五、脂肪酸类及其他类	28
第三节 抗精神失常药	29
一、抗精神病药	29
二、抗焦虑药	34
三、抗抑郁药	34
四、抗躁狂药	36
同步测试	37
第四章 解热镇痛药及非甾体抗炎药	41
第一节 解热镇痛药	41
一、药物概述	41
二、典型药物	43
第二节 非甾体抗炎药	46

一、药物概述	46
二、典型药物	48
同步测试	50
第五章 镇痛药	52
一、吗啡及其衍生物	52
二、合成镇痛药物	55
三、镇痛药的构效关系	59
同步测试	60
第六章 抗组胺药	63
第一节 H ₁ 受体拮抗剂	63
一、药物概述	63
二、典型药物	65
三、组胺 H ₁ 受体拮抗剂的构效关系	69
第二节 H ₂ 受体拮抗剂	69
一、概述	69
二、典型药物	71
三、组胺 H ₂ 受体拮抗剂的构效关系	73
同步测试	74
第七章 拟肾上腺素药	78
一、药物概述	78
二、拟肾上腺素药的一般代谢过程	80
三、拟肾上腺素药物的构效关系	80
四、典型药物	81
同步测试	84
第八章 拟胆碱药和抗胆碱药	86
第一节 拟胆碱药	86
一、药物概述	86
二、典型药物	88
第二节 抗胆碱药	91
一、药物概述	91
二、典型药物	92
同步测试	98
第九章 中枢兴奋药和降糖药	102
第一节 中枢兴奋药	102
一、药物概述	102
二、典型药物	103
第二节 降血糖药	104
一、药物概述	104
二、典型药物	110
同步测试	111
第十章 心血管系统药物	114

第一节 抗心绞痛药	114
一、药物概述	115
二、典型药物	115
第二节 抗心律失常药	117
一、药物概述	117
二、典型药物	118
第三节 抗高血压药	120
一、药物概述	121
二、典型药物	126
第四节 调血脂药	129
一、药物概述	129
二、典型药物	132
第五节 强心药	133
一、药物概述	133
二、典型药物	134
同步测试	135
 第十一章 抗肿瘤药	 140
第一节 生物烷化剂	140
一、药物概述	141
二、典型药物	143
第二节 抗代谢药	145
一、药物概述	146
二、典型药物	149
第三节 其他类抗肿瘤药	151
一、抗肿瘤抗生素	151
二、抗肿瘤的植物有效成分	152
三、金属铂类配合物	153
同步测试	155
 第十二章 化学治疗药	 157
第一节 喹诺酮类抗菌药	157
一、药物概述	157
二、典型药物	159
第二节 磺胺类抗菌药及抗菌增效剂	161
一、药物概述	161
二、典型药物	163
三、抗菌增效剂	164
第三节 抗结核病药	164
一、抗生素类抗结核病药	165
二、合成抗结核病药	165
第四节 其它类型抗菌药	168
第五节 抗真菌药	169
一、唑类抗真菌药	170
二、其它类抗真菌药	171
第六节 抗病毒药	173
一、核苷类	173

二、非核苷类	174
同步测试	175
第十三章 抗生素类药	178
第一节 β -内酰胺类抗生素	178
一、药物概述	178
二、作用机理	183
三、稳定性	184
四、典型药物	185
第二节 大环内酯类抗生素	188
一、药物概述	188
二、典型药物	188
第三节 氨基糖苷类抗生素	188
一、药物概述	188
二、典型药物	189
第四节 四环素类抗生素	190
一、药物概述	190
二、理化性质	191
三、典型药物	192
第五节 其它类抗生素	192
一、药物概述	192
二、典型药物	193
同步测试	194
第十四章 甾体药物	196
第一节 基本结构和分类、命名	196
一、甾体药物基本结构	196
二、甾体化合物的命名	197
第二节 雌甾类药物	197
一、药物概述	197
二、典型药物	199
第三节 雄甾类药物	200
一、药物概述	200
二、典型药物	202
第四节 孕甾类药物	202
一、药物概述	202
二、典型药物	205
同步测试	208
第十五章 维生素类药	211
第一节 脂溶性维生素	211
一、药物概述	211
二、典型药物	214
第二节 水溶性维生素	217
一、药物概述	217
二、典型药物	218
同步测试	222

第十六章 药物研究基本常识	225
第一节 药物的化学结构与药理活性	225
一、药物的基本结构和结构修饰	225
二、药物理化性质对药效的影响	227
三、药物立体结构对药效的影响	228
四、键合特性对药效的影响	230
第二节 药物的变质反应和代谢反应	231
一、药物的变质反应	232
二、药物的代谢反应	234
第三节 新药研究与开发	235
一、新药研究途径和方法	235
二、全新药物设计简介	239
同步测试	241

实训部分

实训一 药物化学实训基本操作	243
实训二 几种常用药物的稳定性实验	251
实训三 药物的配伍变化实验	255
实训四 几种药物的化学鉴别实验（一）	257
实训五 几种药物的化学鉴别实验（二）	259
实训六 二氢吡啶钙离子拮抗剂的合成	262
实训七 磺胺醋酰钠的合成	264
实训八 1,4-二氢-2,6-二甲基-4-（2-硝基苯基）-吡啶-3,5-二羧酸二乙酯的合成	266
实训九 对乙酰氨基酚的合成	268
实训十 阿司匹林的合成	269
同步测试参考答案	271
参考文献	276

理论部分

第一章

绪论

Chapter 01

学习目标

【知识目标】

1. 了解药物化学的起源与发展。
2. 讲出药物化学的任务。
3. 知道药物化学的研究内容和药物化学的学习方法，知道药物的命名基本规则。

【能力要求】

能说出常用药物的主要结构和化学名。

一、药物化学的研究内容和任务

药物在历史发展过程中保证了人类提高生活质量及保持身体健康。药物是具有预防、诊断、治疗疾病及调节机体生理功能的特殊化学物质。全世界大约有 20000 余种药物，无论是天然植物药、矿物药、动物成分药、生物合成药、人工合成药等，本质上皆是由化学元素所构成的化学物质。从天然矿物、动植物中提取的有效成分及经化学合成或者生物合成制得的药物可称为化学药物。现临床使用的药物多为化学药物。

药物化学是研究化学药物的化学结构特征、制备方法、理化性质、稳定性、体内代谢、构效关系、生物效应、不良反应以及寻找新药的一门综合性学科。药物化学以化学知识为基础，在生命科学、医学以及计算机科学的相互渗透下，成为药学领域举足轻重的学科。药物化学一直是卫生系统药学考试和执业药师资格考试的专业知识科目，是药学及相关专业的核心专业课，是药学领域的带头学科。

早期的药物化学主要研究天然药物的有效成分提取和结构研究，随后发展到药物合成、构效关系及衍生物改造等。当时药物化学的英文名称为 Pharmaceutical Chemistry。因化学合成药物的不断涌现，对药物构效关系的深入研究，以及药物体内代谢等临床药学研究的发展，使药物化学的内涵不断丰富，近代药物化学的英文名称改为 Medicinal Chemistry。

药物化学的主要任务是：

第一，为有效而合理地利用现有化学药物提供理论基础。对化学药物的结构与理化性质、稳定性之间的关系研究，不仅可拟定药物的质量标准，还为药物制剂的剂型选择、药物分析、药物配伍禁忌、贮存和保管奠定了化学基础。通过研究药物体内代谢及代谢产物的确定，以及对药物作用机制的认识，既利于剂型设计，也为药物的结构修饰提供重要依据，同时指导制备前体药物与软药。

第二，为生产化学药物提供经济、合理、先进的方法和工艺。研究药物合成路线和工艺条件，配合寻找、发展新原料、新工艺、新试剂、新技术，努力提高药品的产率和质量，降低生产成本，为应用经济、稳定、有效、安全的药物提供保障。

第三，为创制开发新药探索新的途径和方法。开发新药已构成药物化学当前的重要任务。寻找先导化合物是现代新药研究的出发点，近二百年里有 4000 余个化合物作为药物进入临床，这些药物的发现大多经四个途径获得：从天然产物中提取；以现有药物作为新药研究的基础；以药理模型筛选新药；依据病理生理机制设计新药。这些途径也是发现先导化合物的途径。如从中药中分离得到有效成分青蒿素，实验证明其对耐氯喹的疟原虫有极高的杀灭作用，后采用结构修饰方法合成了效果更好的蒿甲醚及青蒿素琥珀酸酯，且毒性低于青蒿素。先导化合物也有通过药物的不良反应而发现的。如磺酰脲类降血糖药甲苯磺丁脲等都是根据磺胺类药物降血糖的副作用经结构改造而发现的；又如因发现磺胺的利尿的副作用是抑制碳酸酐酶后，合成了许多磺酰胺类利尿药如呋塞米等，随后的深入研究最终发现呋塞米等利尿作用并不是抑制碳酸酐酶而是影响髓攀升支的氯化钠重吸收。在采用前述各种方法寻找与优化先导化合物的同时，药物化学与信息技术、计算机科学及分子生物学等学科的融合，也大大促进了新药的研发

二、药物化学的发展简史

人类使用药物已有数千年。通过品尝植物，把带来舒适感或有明确疗效的植物发展成为药物，中国古代传说“神农尝百草”开创了中药的里程碑，人们将产生毒性的植物用于狩猎、战争等，如后来从相关植物中提出的肌松剂筒箭毒碱、汉肌松、傣肌松。19 世纪初起从有效植物中提取得到了具有药理活性的小分子药物，从金鸡纳树皮中提取分离出可抗疟疾的奎宁，从阿片中提纯得到吗啡，从古柯叶中提取得到可卡因，从杨树皮中提取水杨酸等，这些提取物成功证实了那些植物真正有效在于它们所含有的有机化学单体物质，因而为人们利用化学物质替代天然药物开辟了新途径。与此同时 19 世纪中期随着化学工业的飞速发展，人们从有机化合物中筛选药物，如氯仿及乙醚用于全身麻醉，氯醛的水合物用于镇静催眠及麻醉，19 世纪末期对水杨酸进行乙酰化得到解热镇痛药阿司匹林，标志着人类已可用化学合成的方法改造天然化合物的化学结构研制出更理想的药物。

20 世纪初至 20 世纪 60 年代，被认为是药物化学飞速发展的重要时期，在此期间许多重要药物被广泛应用，构效关系的研究也开始兴起，在对可卡因的三种结构的简化过程中，成功筛选出局部麻醉药，即属于对氨基苯甲酸酯的普鲁卡因。染料中间体百浪多息被发现可抗菌，后来发现其代谢产物之一（对氨基苯磺酰胺）有效，由此发展出多系列药物抗菌磺胺与利尿磺胺等。偶然发现的青霉素，开创了人类抗感染治疗药物的另一个里程碑，此后四环素、链霉素、氯霉素、红霉素等抗生素不断面世。随着抗菌药物的广泛应用，它们的缺点也不断暴露，如病原体产生耐药性，人们希望改变抗菌谱、提高抗菌活性，如以 6-氨基青霉烷酸（6-APA）以及 7-氨基头孢烷酸（7-ACA）为基本母核，经过结构改造和修饰，成功得到半合成青霉素与头孢菌素。其他抗生素也基于类似原理成功获得。

20 世纪 60 年代起，以酶或受体为靶标而设计的新药研究获得成功， β 受体阻断剂普萘

洛尔、钙内流阻滞剂硝苯地平、血管紧张素 I 转化酶抑制剂卡托普利成功上市，为人类的心血管疾病治疗做出了巨大贡献。对吗啡和内源性物质脑啡肽和内啡肽的研究，也促进了镇痛药物的研究。

近年来，随着结构生物学、分子生物学、计算机科学等学科以及生物技术、合成及分离技术的高度发展，为人们研究和开发新药提供了新的技术和手段，使药物的设计、生产、制剂制备等更为科学、合理，各种创新药物的发现及研究在不断地深入和完善。



知识链接

青霉素的发现与应用

1928 年 Alexander Fleming 发现金黄色葡萄球菌培养皿中出现了青色杂菌，在显微镜下观察发现杂菌附近的金黄色葡萄球菌全部死亡，此杂菌后来被命名为青霉菌，他推测其代谢产物产生了抗菌作用并称之为青霉素。虽然此研究发表在公开期刊上，但遗憾的是长时间被人忽略。将青霉素用于治疗必须解决两个难题：提纯和大量生产。1940 年 Howard Florey 和 Ernst Chain 通过深入研究，使青霉素最终用于临床并挽救了无数人的生命。1945 年，三位科学家共同获得诺贝尔生理学或医学奖。

青霉菌产生多种代谢产物，药用青霉素是青霉素 G 和青霉素 V，前者即是广为人知的“盘尼西林”。为改进用药方法、改变抗菌谱等，以后成功设计出了多种半合成青霉素，开创了人类的抗生素治疗新时代。

三、药物名称

药物的名称包括药物的通用名、化学名（中文及英文）和药物的商品名。

1. 通用名

中国药品通用名称命名原则，由国家药典委员会组织制定并报国家食品药品监督管理局备案。按照此原则制定的药品名称称为中国药品通用名称（China Approved Drug Names, CADN）。药物的通用名原则主要有：药品名称应科学、明确、简短；词干已确定的译名应尽量采用，使同类药品能体现系统性。药品名称应避免采用可能给患者以暗示的有关药物的药理学、解剖学、生理学、病理学或治疗学的药品名称，并不得用代号。药品英文名应尽量采用世界卫生组织编订的国际非专利药品名称（International Nonproprietary Names for Pharmaceutical Substances, INN），它不受专利和行政保护，是文献、资料、教材及药品说明书中标明的有效成分的名称。INN 没有的，可采用其他合适的英文名称。

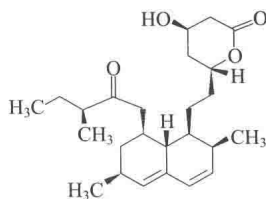
化学药的中文通用名尽量与英文名相对应，可采取音译、意译或音、意合译，一般以音译为主。无机化学药品，如化学名常用且简单，应采用化学名。有机化学药品，化学名较短者亦可采用化学名，如苯甲酸；如化学名称长者，可依据情况采用多种方法命名，如音译命名可待因（Codeine），意译命名氯丙嗪（Chlorpromazine）。制剂命名另有相关细则。

苯妥英（Phenytoin）又名大仑丁，诺氟沙星（Norfloxacin）又名氟哌酸等，是一种惯用的别名，不属法定名称，但常用。

2. 化学名

英文化学名是国际通用的名称，是根据药物的化学结构来命名的。此名采用的系统命名以美国《化学文摘》（CA）为依据。中文化学名以《中华人民共和国药典》（以下简称《中国药典》）收录药品化学名为依据。化学名具体命名方法是以母体名称作为主体名，再连上

取代基或官能团的名称，并按照规定顺序注明取代基或官能团的序号。在母核前的基团次序应按立体化学中的次序规则进行命名，小的原子或基团在先，大的在后，如洛伐他汀。



洛伐他汀

化学名为(S)-2-甲基丁酸(4R,6R)-6-[2-[(1S,2S,6R,8S,8aR)-1,2,6,7,8,8a-六氢-8-羟基-2,6-二甲基-1-萘基]乙基]四氢-4-羟基-2H-吡喃-2-酮-8-酯。

3. 商品名

商品名针对药物的上市产品而言，一般是由药品制造企业选定的名称，在国家商标或专利局注册，受行政和法律保护。在商品名右上标以®表示，具有专属性。商品名必须由国家药品管理部门批准后方可标注和启用。同一成分的药品由于辅料和剂型的不同，或相同辅料制成的仿制药品，不同厂家有不同商品名，故商品名的数目比通用名的数目要多出许多。药品说明书上标注药名顺序一般是：商品名（或商标）、通用名称、英文名称、汉语拼音、化学名称。《中国药典》收载原料药品名称顺序为：通用名、汉语拼音、英文名称、化学名称。

四、药物化学学习方法

药物化学是建立在有机化学和分析化学等药用化学前修课程基础上的专业应用学科，涉及药物品种繁多、结构复杂、临床用途各异等，导致初学者产生畏难情绪。明确学习目标，认真刻苦学习，在学习中取得主动，从学习中找到乐趣，是能学好这门课程的。高职高专药学及相关专业学生，在药物化学学习时应该做到如下几点。

第一，应及时复习基础化学知识尤其是有机化学，要善于联系和运用有机化学知识。化学药物不外乎是由各种官能团构成，以药物的结构为中心，诸多学习内容的掌握就是顺理成章之事，如化学名称、理化性质、立体结构、稳定性、体内代谢、结构修饰、构效关系等都与药物的结构密切相关。

第二，应把握知识主线。要掌握全部药物是不可能的，对于系列药物如巴比妥类、喹诺酮类、青霉素类、四环素类等，在学习过程中掌握药物的共性，进而对药物的个性加以把握，能起到事半功倍之效。

第三，归纳总结、学会记忆、融会贯通。以药物结构为例，学生可总结酯类药物、酰胺类药物、具光学活性药物、前药等内容，加深记忆。药物化学与药理学、药剂学、临床疾病概要、药物分析等学科有许多交叉知识，这些知识既能提高学习兴趣也有助于知识的掌握。如通过对地西洋与奥沙西洋的结构对比，加深对地西洋和奥沙西洋关系的理解，更容易理解前药现象。

第四，认真做实训、练习。药物化学实训是药物化学课程重要的组成部分，学生通过实训规范操作、认真观察实验现象、真实记录实验现象或结果，既提高实验技能也能通过实训掌握重要知识。如普鲁卡因实训项目中，普鲁卡因的水溶液加氢氧化钠溶液即生成白色沉淀；加热，变为油状物；继续加热，产生的蒸气能使湿润的红色石蕊试纸变为蓝色；热至油状物消失后，放冷，加盐酸酸化，即析出白色沉淀。通过此实训能加深对普鲁卡因三种结构的认识和记忆。本书每章都有大量的同步测试，学生课外一定要集中时间完成，检查自己对

总之，任何一门学科知识，学习者只要运用科学学习方法，灵活分析及运用知识，加深理解、记忆，培养自学能力，都是能够掌握好的。

5

学习目标

【知识目标】

1. 了解麻醉药的分类；局部麻醉药的构效关系。
2. 讲出全身麻醉药和局部麻醉药的特点及主要代表药物。
3. 知道麻醉乙醚、氟烷、盐酸普鲁卡因、盐酸利多卡因典型药物的化学结构、理化性质及作用特点。

【能力要求】

1. 能写出麻醉乙醚、氟烷、盐酸普鲁卡因、盐酸利多卡因典型药物的结构特点。
2. 能应用典型药物的理化性质、构效关系解决该类药物的制剂调配、鉴别、贮存保管及临床应用问题。

麻醉药是指能使整个机体或机体局部暂时、可逆性失去知觉及痛觉的药物。根据其作用范围可分为全身麻醉药及局部麻醉药。全身麻醉药作用于中枢神经，使其受到可逆性抑制，从而使意识、感觉和反射消失。局部麻醉药作用于神经末梢及神经干，阻滞神经冲动的传导，使局部的感觉消失。两类药物的作用机制不同，但均能使痛觉消失，达到适于外科手术的要求。

第一节 全身麻醉药

全身麻醉药分为吸入性全麻药和非吸入性全麻药。吸入性全麻药与一定比例的空气或氧气混合后，随吸气进入肺泡，从肺泡膜弥散进入血液，再经血液循环，分布至大脑组织，发挥麻醉作用。非吸入性全身麻醉药，通常为静脉注射给药，麻醉作用发生快，对呼吸道无刺激，不良反应较少，目前临床应用日趋增多。

一、药物概述

吸入性全麻药又称挥发性全麻药。最早在外科手术中使用的全身麻醉药是乙醚、氧化亚氮、氯仿等，但都存在一定的缺点。后发现在低级烃类及醚类分子中引入卤素原子，如氯乙烷、三氯乙烯等，降低了易燃性，但毒性增大，限制了它们的临床使用。目前临床上有应用价值的氟化物为氟烷、甲氧氟烷、恩氟醚等。目前临床上使用吸入性全身麻醉药的副作用较多，仍然需要寻求更理想的药物。

非吸入性全麻药又称静脉麻醉药。这类麻醉药的优点是作用迅速，不刺激呼吸道，不良反应少，使用方便。最早应用的静脉麻醉药为一些超短时的巴比妥类药物，如硫喷妥钠、硫戊巴比妥钠、美索比妥钠。这些超短时巴比妥类药物具有较高的脂溶性，极易透过血脑屏障达

到大脑，因此麻醉作用快。但由于药物的脂溶性强，可迅速由脑组织向其它组织分布，因此麻醉持续时间较短，仅能持续数分钟。近年来，非巴比妥类静脉麻醉药不断发展，已有多种类型使用。如羟丁酸钠、丙泮尼地、依托咪酯、氯胺酮。



课堂活动

讨论：麻醉药与麻醉药品是同一概念吗？

二、典型药物

麻醉乙醚 Anesthetic Ether



本品为无色透明易流动的液体；有特臭、味灼烈、微甜；与乙醇、氯仿、苯、石油醚、脂肪油或挥发油均能任意混合。水中溶解（1：12）。相对密度为 0.713～0.718。馏程为 33.5～35.5℃。有极强的挥发性和燃烧性，蒸气与空气混合后遇火能爆炸。

在日光、湿气、空气作用下易形成过氧化物、醛等杂质。过氧化物及醛对呼吸道有刺激，能引起肺水肿，严重时引起死亡。

本品为吸入全麻药，作用强，毒性小，对骨骼肌松弛完全。使用时易于控制，主要缺点为易燃易爆性、对呼吸道黏膜有刺激性、诱导期长、苏醒慢等。



知识链接

最早麻醉药的发明

在 18 世纪以前，医生做外科手术因为没有使用麻醉剂，手术的死亡率极高，60% 的人在手术中死去。英国著名化学家戴维发现了氧化亚氮。他先在自己身上进行试验，吸入氧化亚氮后产生了一种眩晕的陶醉感，使人的抑制能力降低，很容易发笑，因此，他又将氧化亚氮称为“笑气”。美国牙科医生莫顿向一位化学家杰克逊抱怨牙科手术的苦恼时，杰克逊建议莫顿使用乙醚。莫顿先用猫狗做试验，接着自己也用乙醚进行试验，证明有麻醉作用。后来，莫顿正式将乙醚用于手术前的麻醉。莫顿先将蘸有乙醚的手帕递给患者，让其吸入，使其渐渐失去知觉，然后在助手的帮助下，将牙拔掉。从此后，乙醚作为麻醉药被广泛使用。

氟烷 Halothane



化学名为 1,1,1-三氟-2-氯-2-溴乙烷。

本品为无色易流动的重质液体，类似氯仿气味、味甜。可与乙醇、氯仿、乙醚及非挥发性油类互相混合，微溶于水（1：400），相对密度为 1.871～1.875。

本品遇光、热和湿空气能缓缓分解，通常加 0.01% 的麝香草酚作稳定剂，置于冷暗处密封保存。