

教育部人才培养模式改革和开放教育试点教材

药物化学

主编 尤启冬

中央广播电视大学出版社

教育部人才培养模式改革和开放教育试点教材

药物化学

主编 尤启冬

中央广播电视大学出版社

北京·2002

图书在版编目 (CIP) 数据

药物化学 / 尤启冬主编. —北京: 中央广播电视大学出版社, 2002.7

教育部人才培养模式改革和开放教育试点教材

ISBN 7-304-02269-8

I. 药... II. 尤... III. 药物化学—电视大学—教材 IV. R914

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2002) 第 053852 号

版权所有, 翻印必究。

教育部人才培养模式改革和

开放教育试点教材

药物化学

主编 尤启冬

出版·发行/ 中央广播电视大学出版社

经销/ 新华书店北京发行所

印刷/ 北京市银祥福利印刷厂

开本/ 787×1092 1/16 印张/20.5 字数/465千字

版本/ 2002年5月第1版 2002年7月第1次印刷

印数/ 0001—8000

社址/ 北京市复兴门内大街160号 邮编/100031

电话/ 66419791 68519502 (本书如有缺页或倒装, 本社负责退换)

书号: ISBN 7-304-02269-8/R·21

定价: 27.00元

内 容 简 介

本书是为教育部批准的中央广播电视大学人才培养模式改革和开放教育试点的药学专业编写的，是中央广播电视大学医科类药学专业专科层次统设必修的专业基础课。全书共 17 章，由 4 个部分内容组成。

第 1 部分为第 1 章绪论，主要介绍药物化学的发展、本课程的任务、药品质量标准的概念，作为本课程的介绍。

第 2 部分由第 2~15 章组成，主要介绍各类药物，包括各类药物的发展、结构类型、常用药物的化学结构、化学名、理化性质、鉴别方法及典型药物的合成等内容，使学生对临床使用的重点药物的有关化学及其生物活性问题有初步的认识。

第 3 部分由第 16 章和第 17 章组成，介绍药物化学研究的基本知识，包括药物的化学结构与药效的关系、药物研究与开发的途径和方法，使学生能够理解药物在体内作用的方式、化学结构修饰引起药效的改变，了解新药研究和开发的基本途径和方法。

第 4 部分是药物化学实验，介绍药物化学实验室的基本知识和药物的制备实验，使学生对药物化学的实验知识有初步的认识。

本书在内容安排上尽量压缩药物的合成方法，对与药物的化学鉴别有关的显色反应，大多由药物分析课程介绍，但增加了一些因药物的化学结构变化引起的副作用的内容。本书力求把握对大专层次的要求，对内容的取舍以“必需”、“够用”为原则，既注意教材的科学性、系统性，又体现实用性。

本书是电大药学专业教材，也可供其它成人高等专科相同或相关专业使用。

使用说明

本书是药学专业必修专业基础课“药物化学”课程的教材，本课程共5学分，一学期开设。与之配套的辅助教学媒体还有录像教材和IP课件。在设计过程中，充分考虑不同媒体各自的优势，科学、合理地分配各种媒体的教学内容，文字教材是主要媒体，录像教材是文字教材的强化媒体，IP课件是文字教材的辅助媒体。几种媒体所表现的内容有共同之处，但决不是简单的重复，各媒体互相配合，各有侧重，以便达到最佳教学效果。

1. 文字教材：是教学内容的基本载体，是三种媒体中的核心，学生全部的学习内容及教师对学生的指导、实验尽在其中。为适应现代远程开放教育自主化学习的需要，编者力求使教材在文字叙述上简明流畅、深入浅出，每章前面有“引言”、“学习目标”，教学内容中间穿插“思考题”，章后有“小结”和“习题”。

(1) 引言 每章开头都用一段简练的语言引出本章教学内容，起到承上启下的作用或为学生下一步学习提出应思考的问题。

(2) 学习目标 使学生明确学完本章后要达到的目标和要求，分三个层次：掌握、理解、了解。“掌握”是较高层次的要求，其内容是学习的重点，例如，掌握抗过敏药及抗溃疡药的结构类型。“理解”是一般层次的要求，例如，理解镇痛药的构效关系。“了解”是较低层次的要求，例如，了解定量构效关系的发展。

(3) 思考题 帮助学生复习、巩固本节所学内容。

(4) 小结 用简洁的文字对全章的内容进行总结和概括，使学生对本章内容有整体的了解，可作为复习时的参考，同时培养学生总结、归纳的能力。

(5) 习题 可作为学生巩固本章及前面所学内容的综合练习，检查学习目标实现的程度。

2. 录像教材：是在文字教材的基础上，用形象化手段强调教学内容的重点、难点，讲解分析问题的思路和解决问题的方法。

3. IP 课件及网上内容：在录像教材的基础上，选择制作，放在“电大在线”开放教育网页上，网上内容还有教学大纲、课程教学设计方案、考核说明以及例题解析、阶段总结和辅导等，供学生上网学习使用。

课程组

2001.12

前 言

《药物化学》是药学专业必修的专业基础课程，在学习无机化学、有机化学、生物化学等课程的基础上，主要学习药物结构与药效的关系、药物的理化性质、鉴别方法、合成方法等，为后续课程如药剂学、药用分析化学等的学习打下基础，是全面掌握药学领域各学科知识的重要桥梁。药学专业是教育部批准中央广播电视大学人才培养模式改革和开放教育试点项目之一。本书是按照中央广播电视大学2001年10月组织专家审定的《药物化学》教学大纲编写的，作为电大药学专业专科学员的教材，也可作为其他成人高等专科药学专业和个人自学用书。

随着教育观念的转变，教育的社会化、终身化体系逐步建立，为适应现代远程开放教育自主化和个别化学习的需要，本书将教学内容和学习指导有机地融为一体，每章前面有“学习目标”，教学内容中间穿插“思考题”，章后有“小结”和“习题”。在编写过程中，从培养药学专业高等专科应用性人才的目标出发，教学内容以“必需”、“够用”为原则，以基本概念、基本知识、基本理论为主，理论联系实际，尽量与临床应用结合起来，力求少而精；文字叙述力求通俗易懂，注意启发性，便于自学。

本书共有17章，由4个部分组成。第1部分为第1章 绪论，主要介绍药物化学的发展、本课程的任务、药品质量标准的概念，作为本课程的介绍。第2部分由第2~15章组成，主要介绍各类药物，包括各类药物的发展、结构类型、常用药物的化学结构、化学名、理化性质、鉴别方法以及典型药物的合成等内容，使学生对临床使用的重点药物的有关化学及其生物活性问题有初步的认识。第3部分由第16章和第17章组成，介绍药物化学研究的基本知识，包括药物的化学结构与药效的关系、药物研究与开发的途径和方法，使学生能够理解药物在体内作用的方式、化学结构修饰引起药效的改变，了解新药研究和开发的基本途径和方法。第4部分是药物化学实验。

参加本书编写工作的有中国药科大学教授尤启冬博士（编写第1、12、16、17章和实验）、中国药科大学讲师毕晓玲博士（编写第2~9章、第11、13章）、中国药科大学讲师邵颖博士（编写第10、14、15章）。全书由主编尤启冬教授统稿。

本书由北京大学医学部仇文生、赵维璋、李安良教授等审定，仇文生教授为主审。在此，一并表示感谢。

由于编者水平所限，成稿时间仓促，错误和不妥之处在所难免，敬请广大读者及同行专家提出宝贵意见。

编 者

2001.12

目 录

第1章 绪 论	(1)
1.1 药物化学的内容和本课程的教学要求	(1)
1.2 药物化学发展简介	(2)
1.3 化学药物的质量与杂质的控制	(3)
1.4 药物的名称	(4)
第2章 麻醉药	(6)
2.1 全身麻醉药	(6)
2.2 局部麻醉药	(9)
第3章 镇静催眠药、抗癫痫药和抗精神失常药	(18)
3.1 镇静催眠药	(18)
3.2 抗癫痫药	(28)
3.3 抗精神失常药	(31)
第4章 非甾体抗炎药	(39)
4.1 解热镇痛药	(40)
4.2 非甾体抗炎药	(45)
第5章 镇痛药	(54)
5.1 吗啡及其衍生物	(54)
5.2 合成镇痛药	(58)
5.3 内源性镇痛物质	(63)
5.4 镇痛药物的构效关系	(63)
第6章 中枢兴奋药及利尿药	(66)
6.1 中枢兴奋药	(66)
6.2 利尿药	(71)
第7章 抗过敏药和抗溃疡药	(77)
7.1 抗过敏药	(77)
7.2 抗溃疡药	(86)
第8章 拟肾上腺素药	(94)
8.1 内源性神经递质的生物合成	(94)

8.2	拟肾上腺素药的一般代谢过程	(95)
8.3	拟肾上腺素药的发展	(96)
8.4	拟肾上腺素药的构效关系	(98)
第 9 章	拟胆碱药和抗胆碱药	(106)
9.1	拟胆碱药	(106)
9.2	抗胆碱药	(114)
第 10 章	心血管系统药物	(128)
10.1	抗心绞痛药	(128)
10.2	抗高血压药	(133)
10.3	血脂调节药	(140)
10.4	抗心律失常药	(143)
10.5	强心药	(148)
第 11 章	抗菌药和抗病毒药	(152)
11.1	磺胺类药物及抗菌增效剂	(152)
11.2	喹诺酮类抗菌药	(158)
11.3	抗结核病药	(163)
11.4	抗真菌药	(167)
11.5	抗病素药	(170)
第 12 章	抗 生 素	(175)
12.1	β -内酰胺抗生素	(176)
12.2	四环素类抗生素	(188)
12.3	氨基糖苷类抗生素	(191)
12.4	大环内酯类抗生素	(193)
12.5	氯霉素类抗生素	(197)
第 13 章	抗肿瘤药	(200)
13.1	烷化剂	(200)
13.2	抗代谢药物	(208)
13.3	抗肿瘤天然药物	(215)
13.4	金属配合物抗肿瘤药物	(219)
13.5	其它抗肿瘤药物	(221)
第 14 章	甾类药物	(224)
14.1	雌甾烷类药物	(226)
14.2	雄甾烷类药物	(229)
14.3	孕激素和甾体避孕药物	(232)

14.4	肾上腺皮质激素类药物	(236)
第15章	维生素	(241)
15.1	脂溶性维生素	(242)
15.2	水溶性维生素	(249)
第16章	药物的化学结构与药效的关系	(256)
16.1	影响药物产生药效的主要因素	(256)
16.2	药物理化性质对药效的影响	(257)
16.3	药物的电子云密度分布对药效的影响	(259)
16.4	药物立体结构对药效的影响	(259)
16.5	键合特性对药效的影响	(262)
第17章	药物研究与开发的途径和方法	(266)
17.1	先导化合物的发现	(266)
17.2	先导化合物优化的一般方法	(271)
17.3	定量构效关系简介	(278)
实 验		
一、	实验室基本知识	(281)
1.	实验室注意事项	(281)
2.	常用的实验装置	(283)
3.	实验产率的计算	(290)
4.	实验记录和报告	(290)
5.	合成药物质量控制的基本方法	(291)
6.	药学常用文献介绍	(303)
二、	药物的制备实验	(307)
实验1	阿司匹林的制备	(307)
实验2	磺胺醋酰钠的制备	(310)
实验3	苯妥因钠的制备	(312)

第 1 章 绪 论

(本章课内 1 学时, 录像 25 分钟)

引 言

药物化学是研究药物的发现、合成、化学性质以及与生物体相互作用的一门综合性学科。药物是一种特殊的商品, 其质量的优劣直接与人们的身体健康有密切的关系。

学习目标

你学完本章后应达到如下要求:

1. 掌握化学药物质量和杂质控制的标准。
2. 理解药物命名的基本原则。
3. 了解药物化学的发展及本课程的任务。

1.1 药物化学的内容和本课程的教学要求

药物通常是指对疾病具有预防、治疗或诊断作用的物质, 以及对调节人体功能、提高生活质量、保持身体健康具有功效的物质。根据药物的来源及性质不同, 可以分为中药或天然药物、化学合成药物、生物药物。这些药物中, 有些直接使用天然植物的草、叶、根、茎、皮等; 有的直接用动物脏器、分泌物等; 但有很大一部分是通过化学合成或生物合成的方法得到确切组成的化合物后, 作为药物使用的。药物化学所研究的药物是这类既具有药物的功效, 同时又有确切化学组成的药物, 即化学药物。化学药物可以是无机的矿物质或合成的有机化合物, 从天然药物中提取到的有效单体, 以及通过发酵方法得到的抗生素等等。从这里可以看出化学药物是以化合物作为其物质基础, 以药物发挥的功效(生物效应)作为其应用基础。由此也可以认识到, 以化学药物作为其研究对象的药物化学学科, 是融合化学学科和生命科学学科知识的一门交叉学科。

药物化学是建立在多种化学学科和生物学科基础上的一门学科, 其研究内容涉及药物的发现、发展、鉴定以及药物在体内的作用、变化等。药物化学的研究任务大致为: ①为合理

利用已知的化学药物提供理论基础。通过研究药物的理化性质，阐明药物的化学稳定性，为药物剂型的设计、选择，药物的分析检验、保管和贮存服务。通过药物理化性质的研究及代谢产物的分离鉴定，为进一步认识药物在体内的动力学过程，药物的代谢产物及其可能产生的生物效应提供化学基础。②为生产化学药物提供先进、经济的方法和工艺。③寻找和发现新药，不断探索新药研究和开发的途径和方法。综合运用化学、生物学等学科的理论 and 知识，研究化学结构与生物活性之间的关系（构-效关系），创制疗效好、毒副作用低的新药。创制和发现新药已成为药物化学的一项重要任务。

本课程是药学专业的专业课程，以有机化学、生物化学作为本课程的基础，为药物分析、药剂学课程提供必要的药物的化学知识，还和药理学课程有密切的联系。在本课程的学习中，希望以药物的化学结构为基本信息，以药物产生的生物活性作为评价标准，理解和认识化学药物在体内和体外产生的一系列化学变化，以及化学药物及其体内、体外变化产物与生物体作用的本质及结果，为临床合理用药提供必要的药物化学知识。

思考题 1.1 什么是化学药物？根据临床用药的情况各举一例不同来源的化学药物。

思考题 1.2 药物化学和哪些学科密切相关？

1.2 药物化学发展简介

药物是人类为了繁衍生息而对自然界进行改造的过程中发现和发展起来的，对药物的化学研究则和化学、生物学、医学的研究和发展密切相关。

有史记载以来，人们对药物的应用源于天然物特别是植物，我国就有几千年的应用中医药的历史。到 19 世纪中期，由于化学学科的发展，人类已不满足于应用天然植物治疗疾病，而是希望从中发现有效的化学成分。其中最有影响的工作是从阿片中分离出吗啡，从金鸡纳树皮中提取到奎宁，从莨菪中提取出阿托品，以及从古柯树叶得到可卡因等。这些最早的研究结果说明，天然药物中所含的化学物质是天然药物产生治疗作用的物质基础。另一方面在这个时期，由于化学学科的发展，尤其是有机化学合成技术的发展，临床医学家开始从有机化合物中寻找对疾病有治疗作用的化合物，如用氯仿和乙醚作为全身麻醉药，水合氯醛作为镇静催眠药等都是典型的事例。由于有机合成化学为生物学实验提供了化合物基础的来源，人们在总结化合物生物活性的基础上提出了药效团的概念，指导人们开始有目的的药物合成研究。19 世纪末期发现了苯佐卡因、阿司匹林、氨替比林等一些化学合成药物，药物化学才真正地逐渐形成一门重要的独立的学科。

化学工业的兴起，特别是煤化学工业、染料化学工业等的发展，促进了制药工业的发展。有机化学已由合成简单化合物向合成复杂化合物发展，由杂环化合物的合成到形成杂环化学，扩大了药物的化学结构多样性，加之这一时期药物活性评价已由动物代替人体进行研

究，形成了实验药理学，减少了冒险性，扩大了药物筛选的范围，加快了新药研究的速度，增加了成功的机会，推动了药物化学的发展。

20世纪20年代，解热镇痛药物和局部麻醉药在临床上已有较好应用；30年代磺胺药物的发现，使细菌感染性疾病的治疗有了有效的药物，发展了利用体内代谢产物进行新药的设计和研究，创立了药物的抗代谢作用机制；40年代青霉素用于临床，开创了从微生物代谢产物中寻找抗生素的思路，使药物化学的理论和实践都有了飞速的发展。

20世纪50年代以后，随着生物学科的发展，人们对体内的代谢过程，身体的调节系统，疾病的病理过程有了更多的了解，对蛋白质、酶、受体、离子通道等有了更深入的研究，在心脑血管疾病治疗方面发现了 β -阻滞剂、钙通道阻滞剂、血管紧张素转化酶抑制剂等药物；在肿瘤的化学治疗上，由最初的氮芥、烷化剂，发展到有目的的进行细胞生长周期的调控，使大部分肿瘤治疗效果有较大的提高。60年代由于定量构效关系的研究，使药物化学的发展由盲目的设计到有目的的合理设计，极大地丰富了药物化学的理论。80年代以后，计算机学科的图像学技术的应用，使药物设计更加合理、可行，组合化学方法的发展，使快速大量合成化合物成为可能；高通量和自动化筛选技术的应用，缩短了药物发现的时间，大大加快了新药寻找过程，生物技术特别是分子克隆技术、人类基因组学、蛋白组学的形成和发展，为新药研究提供了更多的靶点。

1.3 化学药物的质量与杂质的控制

化学药物是对疾病有预防、治疗等用途的化学物质，其质量的优劣直接与人们的身体健康有密切的关系。

药品的质量首先取决于药物自身的疗效和毒副作用，即安全性和有效性。药物在发挥有效性的同时，应不产生或较少产生副作用。药物副作用的产生，一方面来自药物对体内其它受体、酶、器官等的作用；另一方面也可能来自药物中存在的杂质或药物的代谢产物。

药物的杂质是指在生产、贮存过程中引进或产生的药物以外的其它化学物质，包括由于分子手性的存在而产生的非治疗活性的光学异构体。杂质的存在不仅影响药物的纯度，同时还会带来非治疗活性的副作用，必须加以控制，通常要规定药物的杂质限度。药物中杂质限度制订的依据是在不影响疗效、不产生毒副作用的原则下，便于制造、贮存和生产，允许某些杂质的存在有一定的限量。

对于药物杂质限度的规定、药物纯度的规格，必须按照药品标准执行。我国的药品标准有《中华人民共和国药典》和《国家药品标准》。药品在未列入国家药典之前，都按国家药品标准执行。

思考题 1.3 什么是药物的杂质？请举例说明。

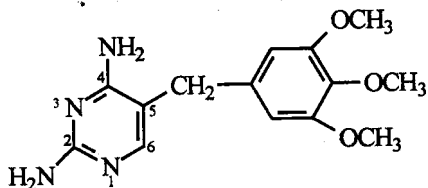
思考题 1.4 制订药物杂质限度的原则是什么？如何理解？

1.4 药物的名称

药物的名称包括药物的通用名、化学名和商品名。

药物的通用名多采用世界卫生组织推荐使用的国际非专利药品名称 (INN)，它是新药开发者在新药申请时向政府主管部门提出的正式名称，不受专利和行政保护，也是文献、资料、教材以及药品说明书中标明有效成份的名称。我国药典委员会制订并编写了《中国药品通用名称 (CADN)》，基本是以 INN 为命名依据，INN 没有的，则采用其它合适的英文名称为命名依据。CADN 是中国药品命名的依据，也是药典收录的药物的名称。CADN 的中文名尽量与英文名相对应，可采取音译、意译或音、意合译，以音译为主。对 INN 常采用的词干规定了其对应的中文译名。例如 Amitriptyline，其中-triptyline 的中文译名为“-替林”，整个药名音译为阿米替林。

药物的化学名是根据其化学结构式来进行命名的，以一个母体为基本结构，然后将其它的取代基的位置和名称标出。化学名称可参考国际纯化学和应用化学会 (IUPAC) 公布的有机化合物命名原则及中国化学会公布的有机化合物命名原则 (1980 年) 进行命名。由于美国化学文摘 (CA) 应用范围日益扩大，已被广泛接收，也成为药品化学命名的基本依据。化学命名的基本原则是从化学结构选取一特定的部分作为母体，规定母体的位次编排法，将母体以外的其它部分均视为其取代基，对于手性化合物规定其立体构型或几何构型。例如：



甲氧苄啉 (Trimethoprim)，以嘧啶环为母体，(3, 4, 5-三甲氧基苯基) 甲基为取代基，其化学命名为：5-[(3, 4, 5-三甲氧基苯基)甲基]-2, 4-嘧啶二胺。

药物的商品名是制药企业为保护自己开发的产品的生产权和市场占有权而使用的名称，以此来保护自己并努力提高产品的声誉。商品名可以得到注册保护，但取用时不能暗示药物的疗效。

药物的三种名称在药品的说明书中都会出现，但在药品的标准和国家药典中只有药品通用名和化学名。

思考题 1.5 查找中国药典，写出下列药物的化学名和结构式：阿司匹林、盐酸哌替啶、诺氟沙星

思考题 1.6 找出两份常用的或接触较多的药品说明书，指出什么是药品的商品名，通用名和化学名。

小 结

1. 药物化学研究对象是化学药物，研究的内容是：药物的理化性质、体内的变化，药物的发现和发展，药物体内作用的化学过程等。

2. 药物的杂质是指在生产、贮存过程中引进或产生的药物以外的其它化学物质，必须加以控制。药物杂质限度制订的依据以疗效和毒副作用作为评判标准。

3. 药物的名称有通用名、化学名和商品名，各自的用途和使用场合不同。其中通用名是药品的正式名称，化学名是药品的化学结构的表现。

习 题

1. 什么是药物？什么是化学药物？根据药物的来源不同，化学药物有哪几大类型？

2. 举例说明药物化学的研究内容和任务。

3. 什么是药物的副作用？药物副作用产生的因素有哪些？

4. 药物的杂质是指哪些物质？有哪些来源？为什么要制订药物中杂质的限度？

5. 同样是 95% 浓度的乙醇，化学纯级的乙醇和药用级的乙醇有什么差别？能否相互代用？为什么？

6. 写出三个常用药物的通用名和化学名。

第2章 麻醉药

(本章课内2学时, 录像25分钟)

引言

麻醉药 (Anesthetic Agents) 主要分为全身麻醉药 (General Anesthetics) 和局部麻醉药 (Local Anesthetics) 两大类。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。局部麻醉药则作用于神经末梢或神经干, 可逆性地阻断感觉神经冲动的传导, 在意识清醒状态下使局部疼痛暂时消失。两类药物虽然作用机制不同, 但均能使痛觉消失, 临床用于外科手术。

学习目标

你学完本章后应达到如下要求:

1. 掌握麻醉药的分类及重要药物的作用特点。
2. 了解局麻药的发展过程, 理解局麻药的构效关系和分类。
3. 掌握氟烷、甲氧氟烷、恩氟烷、异氟烷、硫喷妥钠、氯胺酮的结构, 理解麻醉乙醚、七氟烷、羟丁酸钠的结构, 掌握普鲁卡因、丁卡因、利多卡因、布比卡因的结构、化学名、理化性质及应用, 理解普鲁卡因的合成方法。

2.1 全身麻醉药

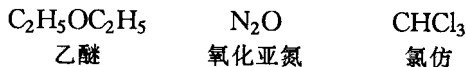
全身麻醉药分为吸入性麻醉药和静脉麻醉药两大类, 适用于大手术。

2.1.1 吸入性麻醉药

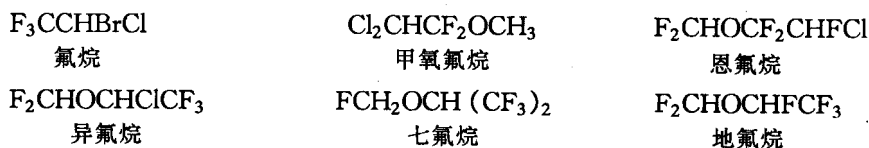
吸入性麻醉药为一类化学性质不太活泼的气体或易挥发的液体, 与一定比例的空气或氧气混合后, 经呼吸进入肺部, 扩散进入血液, 随血液循环分布至神经组织而发挥全身麻醉作用。

最早应用于外科手术的全身麻醉药有乙醚 (Ether, 1842年)、氧化亚氮 (Nitrous Ox-

ide, 1844年)和氯仿(Chloroform, 1847年)等。乙醚的麻醉作用较强,并有良好的镇痛及肌肉松弛作用,但由于易燃易爆、对呼吸道粘膜刺激性较大和诱导期较长等缺点,现已少用。氧化亚氮的麻醉作用较弱,在80%~85%的浓度时才能产生麻醉作用,因此常与其它全麻药合用,可减少其它全麻药的用量。氯仿由于毒性大,已被淘汰。



后来,在低分子量的烃类及醚类分子中引入氟原子,可降低易燃性,增加麻醉作用,因而发展了一类含氟麻醉药,现在临床上含氟的全麻药几乎完全可以取代早期的全麻药。临床上有应用价值的含氟药物有氟烷(Halothane)、甲氧氟烷(Methoxyflurane)、恩氟烷(Enflurane)、异氟烷(Isoflurane)、七氟烷(Sevoflurane)、地氟烷(Desflurane)等。



氟烷的麻醉作用强而迅速,约为乙醚的2~4倍,麻醉诱导期短,恢复快,停药后病人立即苏醒,对呼吸道粘膜刺激性小,不易燃不易爆,但对心、肝、肾有一定的毒性,可用于全身麻醉及诱导麻醉。

甲氧氟烷的麻醉、镇痛及肌肉松弛作用较氟烷强,麻醉诱导期长(约20 min),持续时间也较长,对呼吸道粘膜刺激性小,不易燃、不易爆,对心、肝、肾也有一定的毒性,本品可用于各种手术的麻醉和诱导麻醉。

恩氟烷为新型高效的吸入麻醉药,麻醉作用强,起效快,对呼吸道粘膜无刺激性,肌肉松弛作用也较强,使用剂量小,为临床常用药物。

异氟烷是恩氟烷的异构体,作用与恩氟烷相似,诱导麻醉及苏醒较快,也为临床常用药物。

七氟烷是继恩氟烷、异氟烷之后开发的一种新型吸入麻醉药,麻醉诱导期短,苏醒快,毒性小,对肝、肾无直接损害,适用于小儿、牙科及门诊手术时的麻醉。

地氟烷是1992年推出的一种新的吸入麻醉药,其化学性质稳定,麻醉诱导快,术后恢复期短,对肝、肾功能无明显影响,适合门诊手术使用。

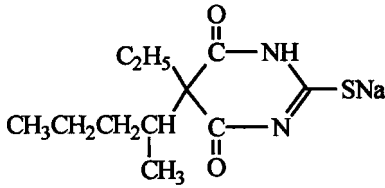
由于吸入性全身麻醉药对操作者(长期接触)的肝功能有一定的影响,故吸入性全麻药的使用受到限制,多以静脉麻醉药或局部麻醉药代替。

2.1.2 静脉麻醉药

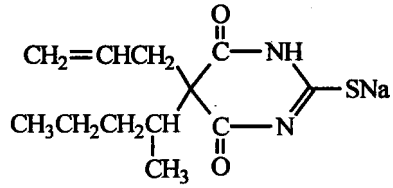
静脉麻醉药又称为非吸入性全身麻醉药。这类药物通过静脉注射给药,麻醉作用迅速,对呼吸道无刺激作用,不良反应少,在临床上占有重要地位,常用于吸入全麻的诱导以及在复合全麻中应用。

最早应用的静脉麻醉药为超短时的巴比妥类药物,有硫喷妥钠(Thiopental Sodium)、

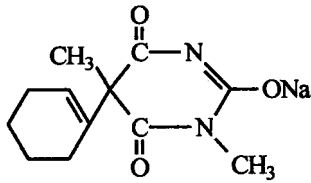
硫戊妥钠 (Thiamyltal Sodium)、海索比妥钠 (Hexobarbital Sodium)、美索比妥钠 (Methohexital Sodium) 等。



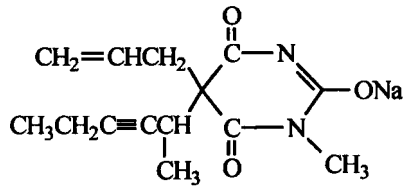
硫喷妥钠



硫戊妥钠



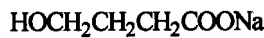
海索比妥钠



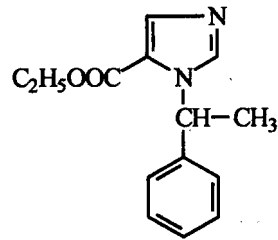
美索比妥钠

这些巴比妥类药物由于脂溶性较高，极易通过血脑屏障到达脑组织而产生麻醉作用，因此麻醉作用快。由于药物的脂溶性强，亦可迅速地由脑组织分布到其他组织，因此麻醉持续时间较短，一般仅能维持数分钟。临床上主要用于诱导全麻和基础麻醉，与吸入麻醉药配合使用。

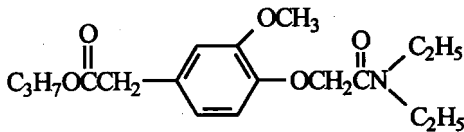
近年来，非巴比妥类静脉麻醉药不断发展，品种日益增多。在临床上有应用价值的药物有：羟丁酸钠 (Sodium Hydroxybutyrate)、丙泮尼地 (Propanidid)、依托咪酯 (Etomidate)、氯胺酮 (Ketamine)、普鲁泊福 (Propofol)、阿芬太尼 (Alfentanil) 等。



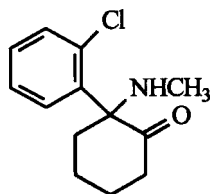
羟丁酸钠



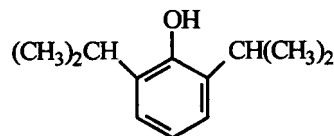
依托咪酯



丙泮尼地



氯胺酮



普鲁泊福