



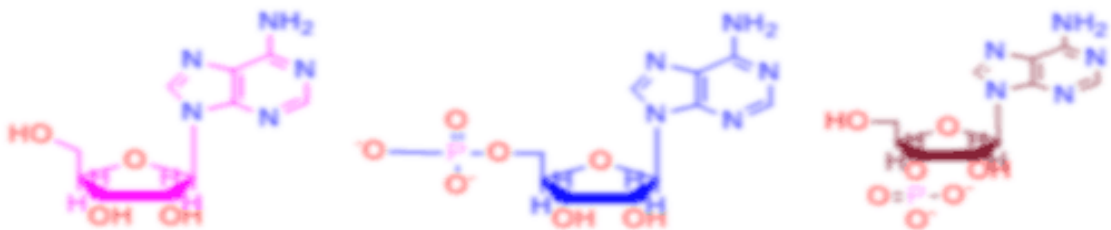
安徽中醫藥高等專科學校

2019 安徽省《藥物化學》精品線下開放課程

安徽中醫藥高等專科學校 | 藥學系

Anhui College of Traditional Chinese Medicine | Department of Pharmacy

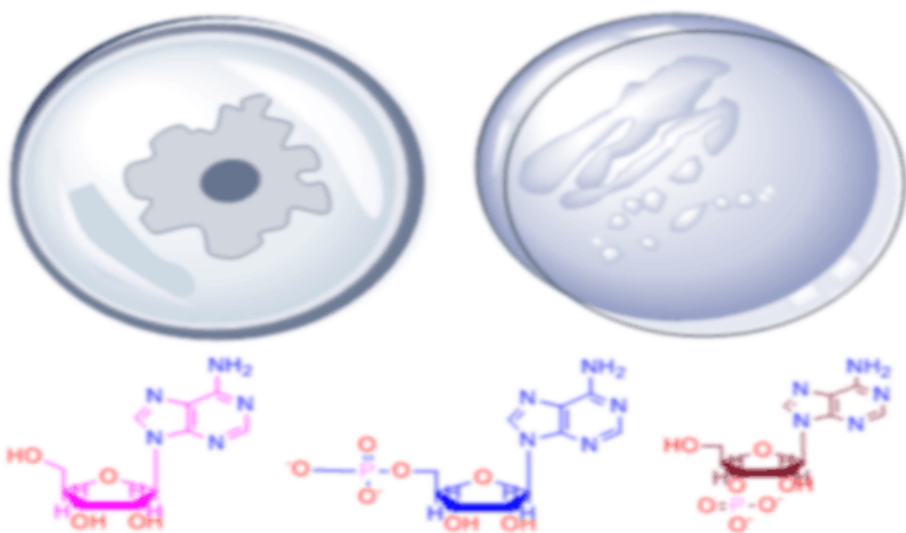
藥物化學與藥物分析教研室 | 張曉沖





第八章 解热镇痛药及非甾体抗炎药

第一节 解热镇痛药





解热镇痛药中的典型药物



(一) 阿司匹林

(二) 对乙酰氨基酚



(一) 阿司匹林

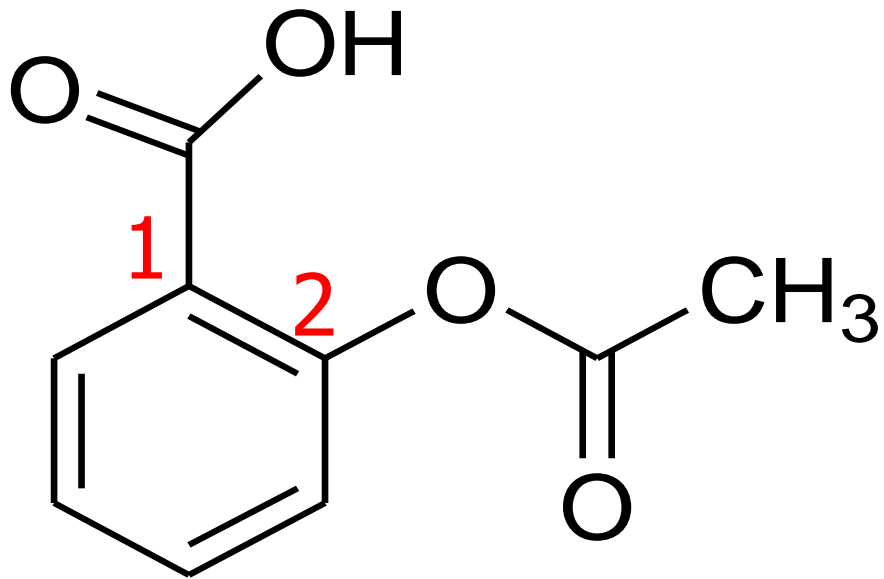
(一) 阿司匹林

- | | |
|-------|-----------|
| 15世纪 | 咀嚼柳树皮 |
| 1838年 | 提取水杨酸 |
| 1875年 | 水杨酸钠用于临床 |
| 1886年 | 水杨酸苯酯用于临床 |
| 1898年 | 合成阿司匹林 |



柳树皮是柳树的树皮。古代中国和西方国家，都有把柳树皮入药的记录。柳树皮含有天然的水杨苷，吸收后经酵素转化成水杨酸，更是一种天然的止痛药。

(一) 阿司匹林



化学名：2-（乙酰氧基）苯甲酸
又名乙酰水杨酸

(一) 阿司匹林



1、理化性质

- 白色结晶或结晶性粉末。味微酸。微溶于水，易溶于乙醇，可溶于乙醚、氯仿。
- 呈弱酸性，可溶于NaOH/NaCO₃水溶液。
- 熔点为135-140℃

典型药物

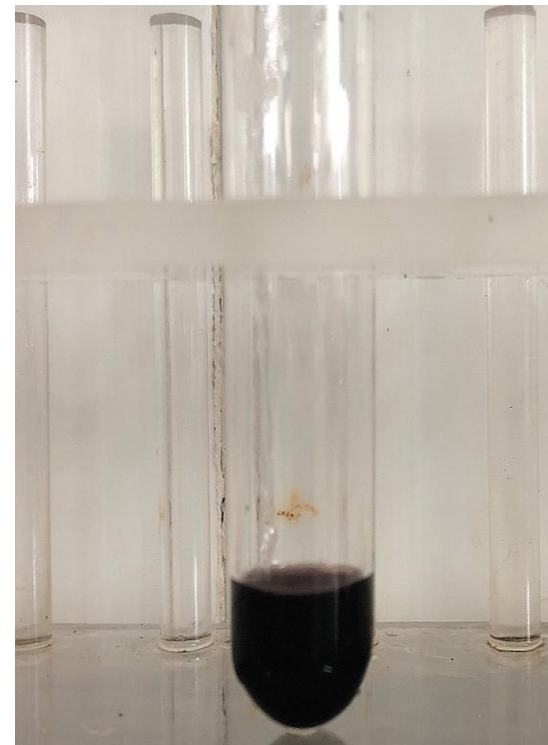
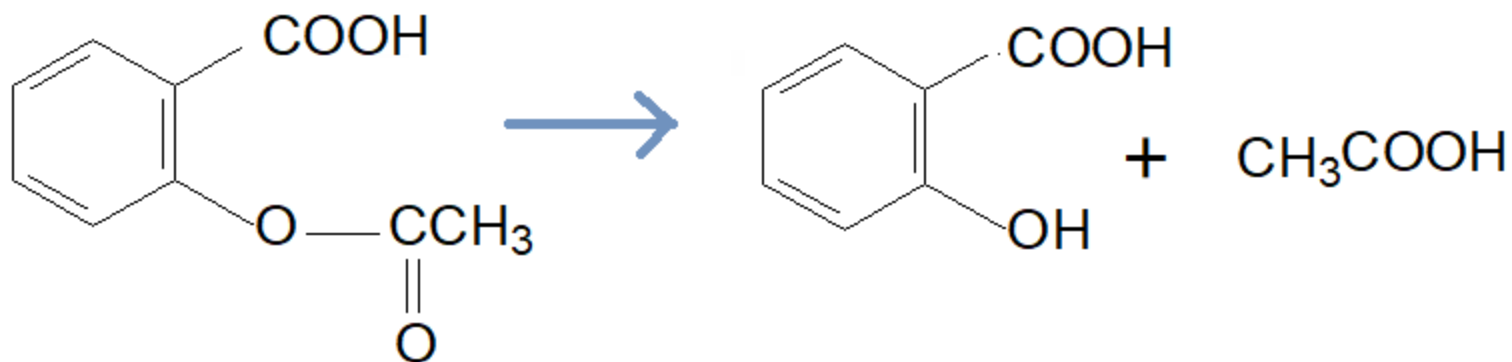
(一) 阿司匹林

2、鉴别

(1) 显色反应：水解为水杨酸+铁盐→紫堇色

药典规定检查游离水杨酸

(2) 水解、酸化→水杨酸（沉淀）+醋酸

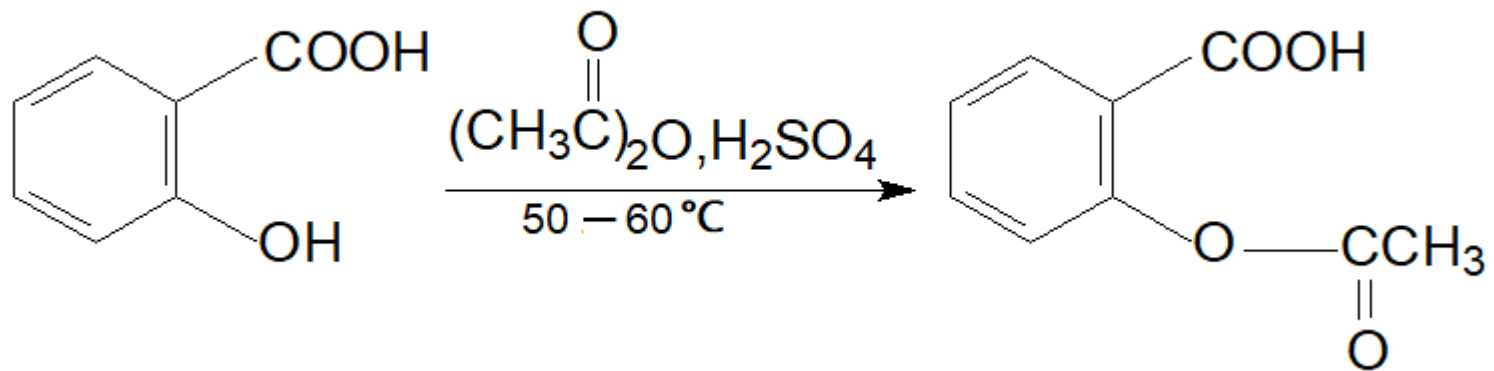




典型药物

(一) 阿司匹林

3、合成





(一) 阿司匹林

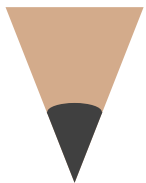
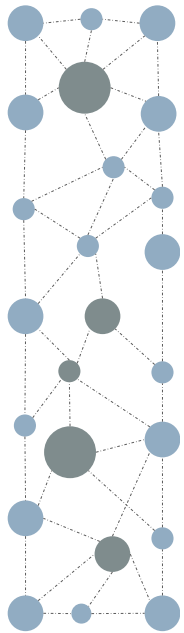
4、药效

用于发热、头痛、牙痛、神经痛、肌肉痛等慢性钝痛，也可用于风湿、类风湿关节炎，还可预防血栓形成。

对胃黏膜有刺激，长期服用易引起胃及十二指肠出血。建议餐后服用。

阿司匹林的用途

The use of aspirin

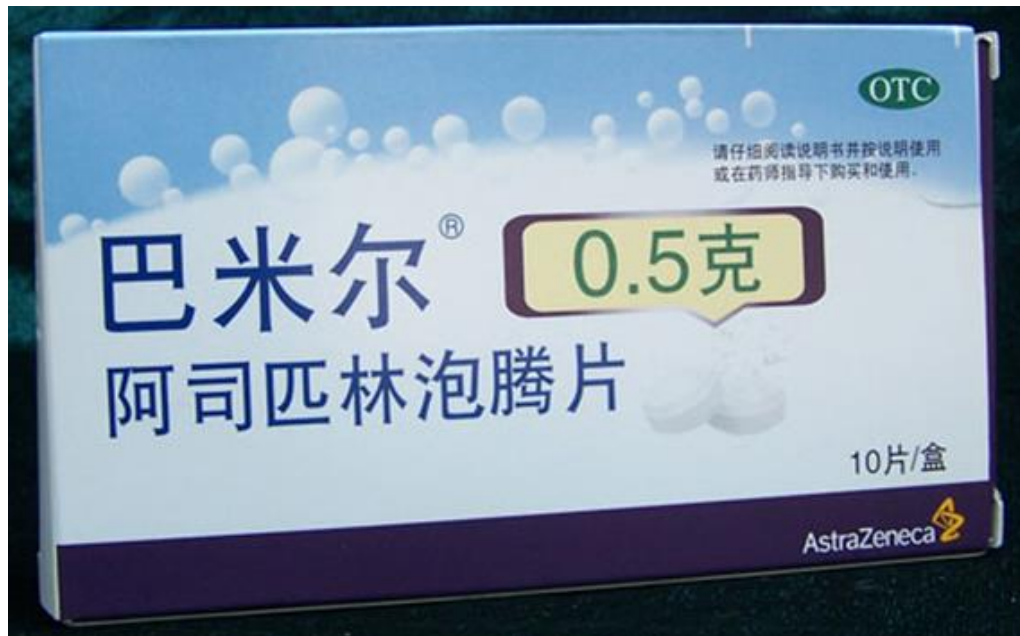


-----● 解热、镇痛、抗炎、预防血栓等

-----● 为减少胃部刺激性，可做成肠溶片

典型药物

(一) 阿司匹林



- 它的优点在于崩解快速、服用方便、起效迅速；特别适用于儿童、老年人以及吞服困难的患者；经过调味后的泡腾片，口味更佳，使病人更乐于接受。

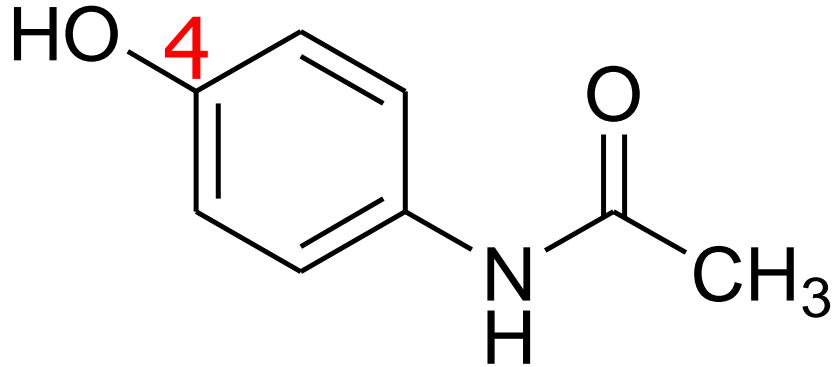


(二) 对乙酰氨基酚



典型药物

(二) 对乙酰氨基酚



化学名：*N*-（4-羟基苯基）-乙酰胺



(二) 对乙酰氨基酚

1、理化性质

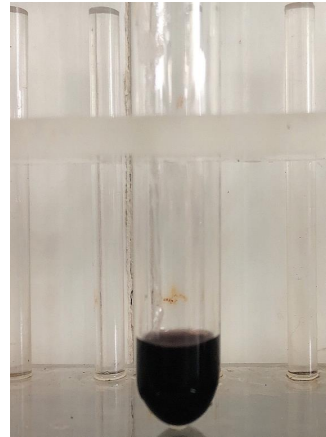
- 白色结晶或结晶性粉末，无臭，味微苦，易溶于热水或乙醇，在冷水中略溶，水溶液呈弱酸性。

(二) 对乙酰氨基酚

2、鉴别

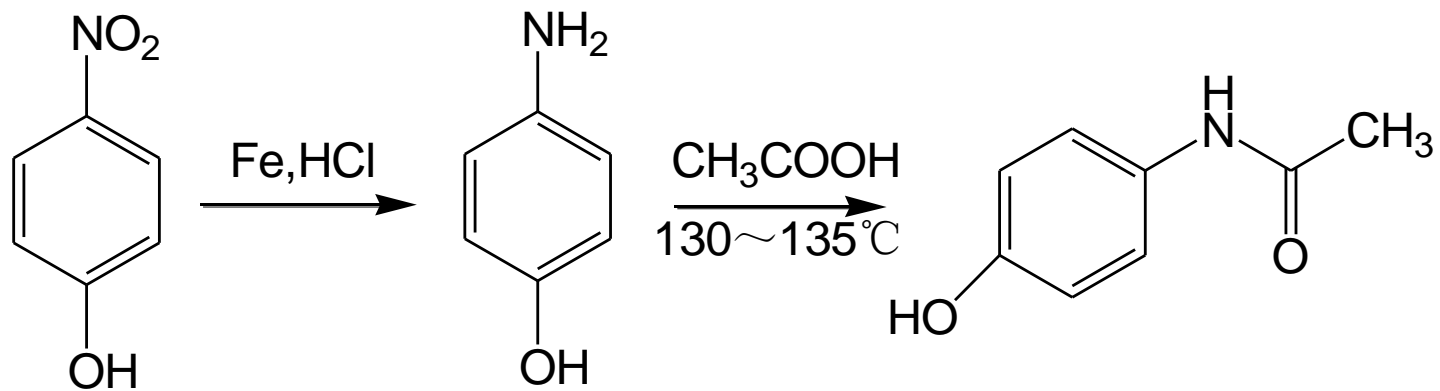
- ①含酚羟基 + FeCl_3 , 生成蓝紫色。
- ②水解 → 对氨基苯酚 (重氮化偶合反应)
- ③水解 → 对氨基苯酚 (毒性大, 限量检查)

对氨基苯酚 + 亚硝酰铁氰化钠 →
蓝色配位化合物



(二) 对乙酰氨基酚

3、合成



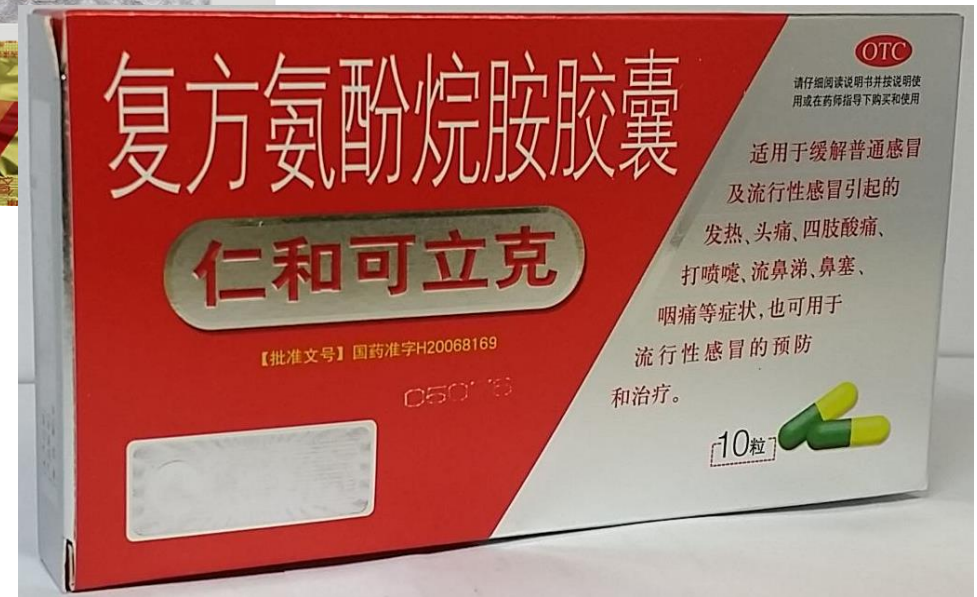


(二) 对乙酰氨基酚

4、药效

用于发热、头痛、关节痛、神经痛等，常用作复方感冒药物的成份之一。但不能用药过量。

含有对乙酰氨基酚的常用药：

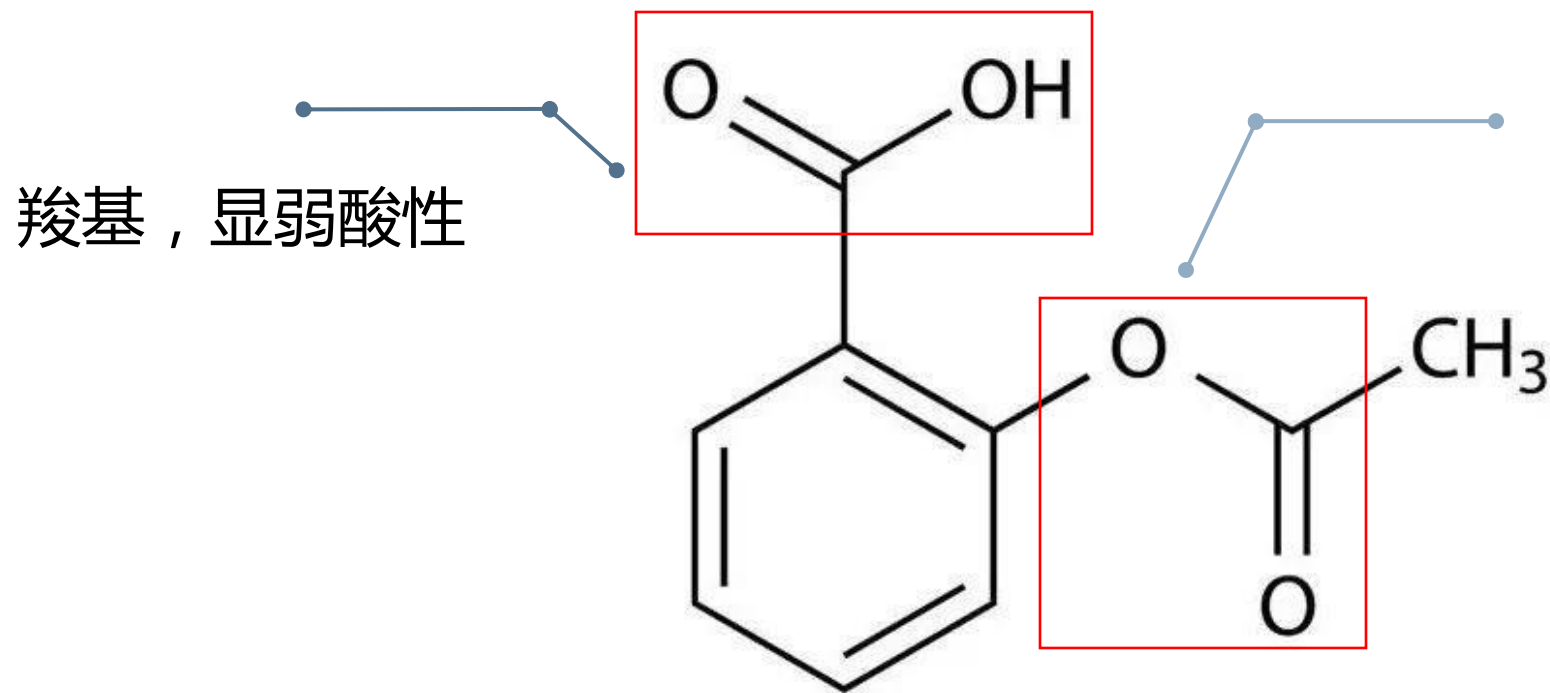




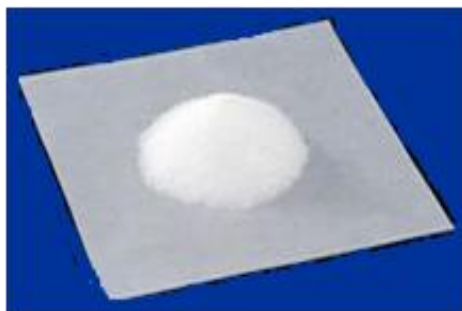
(三) 小结

1、阿司匹林

水杨酸类



1、阿司匹林



性状

本品为白色结晶
或结晶性粉末



熔点

135 ~ 140°C

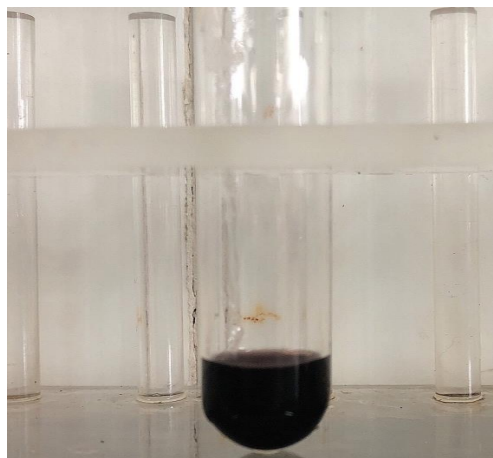


溶解性

微溶于水，易溶于乙醇，可溶于乙醚、氯仿，在氢氧化钠溶液或碳酸钠溶液中溶解。

物理性质

1、阿司匹林



显色反应 阿司匹林分子中无游离酚羟基，不与三氯化铁显色。但其水溶液加热或长期放置后，会水解生成水杨酸，遇三氯化铁显紫堇色。（如左图）



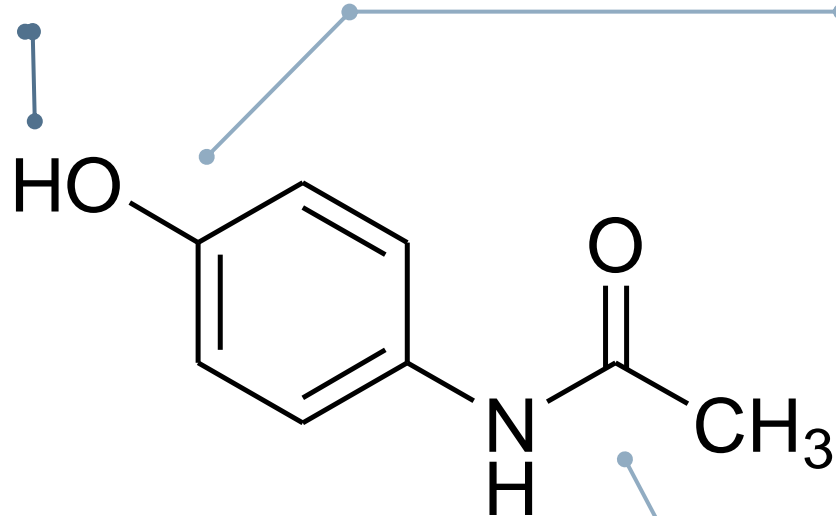
沉淀反应 阿司匹林在氢氧化钠溶液或碳酸钠溶液中水解生成水杨酸和醋酸，加热时水解更快。酸化后产生醋酸酸臭，并析出水杨酸沉淀。



小结

2、对乙酰氨基酚 苯胺类

弱酸性



含酚羟基 + FeCl₃, 生成蓝紫色。

水解 → 对氨基苯酚 (重氮化偶合反应)



2019 安徽省《药物化学》精品线下开放课程

安徽中医药高等专科学校 | 药学系

Anhui College of Traditional Chinese Medicine | Department of Pharmacy

药物化学与药物分析教研室 | 张晓冲