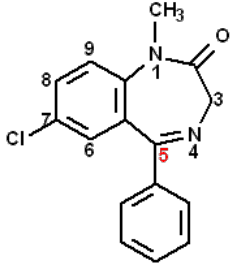


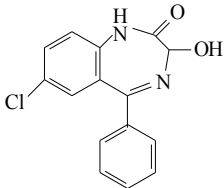
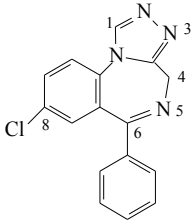
山西药科职业学院

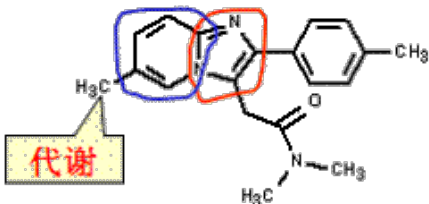
教 学 设 计 方 案

课程：药物化学

授课内容		模块二 镇静催眠药、抗癫痫药、抗精神失常药			
		单元一 镇静催眠药			
专业		药学、药检、药物制剂	课 时	2	课 型
					理论课
教学 目标	知识 目标	1. 说出镇静催眠药的化学结构类型及典型药物。 2. 讲出地西洋、奥沙西洋、艾司唑仑的结构特点、理化性质、代谢特点、作用特点及用途。 2. 认识唑吡坦的化学结构并说出其的结构特点、作用特点。 3. 简述苯并二氮杂卓类药物的构效关系。			
	能力 目标	1. 知道地西洋、奥沙西洋的体内代谢过程。 2. 学会根据典型药物的结构特点推导其化学性质的方法。 3. 能用化学方法鉴别地西洋与奥沙西洋。			
	素质 目标	树立良好的职业道德。			
	德育渗透	珍爱生命。			
教学方法使用及教学媒体设计		1. 教学方法：讲授法、讨论法。 2. 教学媒体：多媒体、药品说明书、药品包装盒、板书。			
新知识 新技术		新型镇静催眠药			
双语教学		sedative-hypnotics 镇静催眠药			
重 点 难 点 及处理		重点：地西洋 难点：体内代谢 处理：化学结构→体内代谢			
参考书目		《药物化学》 人民卫生出版社 刘文娟 主编 《药物化学》 中国医药科技出版社 刘文娟 主编			

授课内容	重点设计
【前提诊断】 1. 非甾体抗炎药分为哪几类？各有哪些典型药物？ 2. 吲哚美辛、布洛芬、萘普生、吡罗昔康的酸性分别是由哪个基团引起的？ 3. 地西洋的别名是什么？	5min 教师提问
【导入新课】 传统的镇静催眠药（如巴比妥类等）都是普遍性中枢抑制药，随剂量逐渐增加而产生镇静、催眠、嗜睡、抗惊厥和麻醉作用，中毒量可致呼吸麻痹而死亡。曾认为这是镇静催眠药的一般作用规律。但 60 年代开始应用的苯二氮卓类并不符合上述规律，即使很大剂量也不引起麻醉。由于苯二氮卓类有较好的抗焦虑和镇静催眠作用，安全范围大，目前已完全取代了巴比妥类等传统镇静催眠药。	2min
【讲授新课】 模块二 镇静催眠药、抗癫痫药和抗精神失常药 镇静催眠药 抗癫痫药 抗精神失常药 } 中枢抑制药 单元一 镇静催眠药 本类药物按化学结构可分为： { 巴比妥类：苯巴比妥（现已少用） 苯二氮卓类：地西洋 其他类：唑吡坦 地西洋 （一）结构  结构特点： （1）苯并二氮（卅卓）基本母核	65min 举例 举例 板书结构，解释“苯二氮卓”

(2) 1 甲基, 5 苯基, 7 氯 (二) 性质及应用 (苯并二氮 (卅卓) 的 <u>共有的性质</u>) 有内酰胺 (1,2 位) 和亚胺 (4,5 位) 结构, 化学性质不稳定 (1) 水解开环发生在 1,2 位或 4,5 位, 两反应平行进行; (2) <u>4,5 开环是可逆的</u>, 在体温和酸性条件下, 4,5 位间开环水解, 当 pH 提高到中性时重新环合, 不影响生物利用度 (三) 作用机制 与中枢苯二氮卓受体结合 (四) 代谢 (在肝脏进行) 可得到活性代谢物 (1) N¹ 位去甲基; (2) C³ 位羟基化。 代谢产物奥沙西洋仍有活性。 奥沙西洋 (一) 结构  结构特点: (与地西洋比较) (1) N¹ 位去甲基; (2) C³ 位羟基化。 (二) 性质与地西洋相似 特殊反应: 水解产物为芳香第一胺, 可发生重氮化偶合反应。 艾司唑仑 (一) 结构  结构特点: (1) 区别是 1,2 位并入三氮唑; (2) 6 苯基, 8 氯 (二) 性质及应用 (1) 1, 2 位不易水解, 增加了稳定性; (2) 在酸性条件下, 室温即可使 5,6 位亚胺键水解, 碱性条件下, 也会可逆性闭环, 不影响生物利用度;	结构推导性质 性质推导代谢 共性 引出奥沙西洋 比较法 与地西洋区别 “唑仑”与 “西洋”比较
---	---

(三) 作用特点 引入三唑环增强了与受体的亲和力和代谢的稳定性，增加了药物的活性。 苯二氮卓类药物构效关系： (1) 3 位引入羟基降低毒性，并产生手性碳，其光学异构体活性有差别。 (2) 7 位有吸电子基可增加活性，吸电子越强，作用越强，其次序为 $\text{NO}_2 > \text{Br} > \text{CF}_3 > \text{Cl}$ (3) 5 位的苯是产生药效的重要基团，5 位苯环的 2' 位引入体积小的吸电子基团（如 F、Cl）可使活性增强。 (4) 1,2 位并入三氮唑可提高稳定性，并提高与受体的亲和力，活性显著增加。 (5) 1 位取代基在体内代谢去烃基，仍有活性。 唑吡坦  结构特点：咪唑并吡啶 作用机制：选择性与苯二氮卓 ω_1 受体结合，耐药性依赖性低。	总结 与酒石酸成盐
【课堂小结】 本节课简单介绍了镇静催眠药的分类；重点讲解了地西洋、奥沙西洋、艾司唑仑的化学结构、理化性质；另外还介绍了唑吡坦的特点。同学们要学会根据化学结构推导演化性质。	5min 用彩色粉笔标示重点内容
【布置作业】 1. 如何用化学方法区分地西洋和奥沙西洋？ 2. 查资料：苯妥英钠。	3min 同学记录