

复习总结：胺类药物 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/17/2021_2022__E5_A4_8D_E4_B9_A0_E6_80_BB_E7_c23_17098.htm

胺类药物盐酸普鲁卡因的化学性质：芳伯胺基特性，可显重氮化-偶合反应，与芳醛缩合反应，易氧化变色等。酯键易水解特性。水解产物主要为对氨基苯甲酸（PABA）。游离碱难溶于水且碱性弱。对乙酰氨基酚的化学性质：水解产物呈芳伯胺基特性。药物结构中有酰胺基，在酸性溶液中易水解得具有芳伯胺基的产物。因此药物的水解产物可具有芳伯胺基特性反应。

水解产物易酯化。对乙酰氨基酚水解后产生醋酸，可在硫酸介质中与乙醇反应，发出醋酸乙酯的香味。与三氯化铁发生呈色反应。对乙酰氨基酚具酚羟基，可与三氯化铁发生呈色反应。盐酸普鲁卡因的鉴别：重氮化-偶合反应。颜色：橙红色到猩红色。水解产物的反应。盐酸普鲁卡因具对氨基苯甲酸酯的结构，遇氢氧化钠试液即析出白色沉淀，加热变为油状物（普鲁卡因），继续加热可水解，产生挥发性二乙氨基乙醇，能使湿润的红色石蕊试纸变为蓝色，同时可生成可溶于水的对氨基苯甲酸钠，放冷，加盐酸酸化，即生成对氨基苯甲酸的白色沉淀。红外吸收光谱。对乙酰氨基酚鉴别：重氮化-偶合反应。水解后反应，颜色：红色。三氯化铁反应。对乙酰氨基酚的水溶液加三氯化铁试液，即显蓝紫色。对乙酰氨基酚的杂质检查：除了检查酸度、氯化物、硫酸盐、重金属、水分和炽灼残渣外，还需检查以下项目：1. 乙醇溶液的澄清度与颜色。2. 有关物质。薄层色谱检查对氯乙酰苯胺。3. 对氨基酚。为芳香第一胺，能与亚硝基铁氰化钠在

碱性条件下生成蓝色配位化合物，而药物对乙酰氨基酚无此呈色反。（对氨基酚对照溶液不稳定，应临用前新鲜配制）

盐酸普鲁卡因注射液中对氨基苯甲酸的检查采用硅胶H-CMC薄层色谱法检查。对氨基苯甲酸的最低检出量为 $0.01\ \mu\text{g}$ 。除主斑点盐酸普鲁卡因和分解产物对氨基苯甲酸外，还有一个杂质斑点，确证为苯胺，最低检出量为 $0.01\ \mu\text{g}$ 。

含量测定方法：亚硝酸钠滴定法。具有芳伯氨基的药物（如盐酸普鲁卡因及其片剂）乙基水解后又芳伯氨基的药物（如对乙酰氨基酚）均可用亚硝酸钠滴定法测定含量。

1. 原理：芳伯氨基药物在酸性溶液中与亚硝酸钠定量反应，生成重氮盐。永停法指示终点。

2. 主要测定条件：加入适量溴化钾加速反应（加快重氮化反应速度）。加入强酸加速反应（使重氮化反应速度加快；重氮盐在酸性溶液中稳定；防止偶氮氨基化合物的生成）。一般加入盐酸的量按芳胺与酸的摩尔比 $1:2.5\sim 6$ 。室温（ $10\sim 30$ ）条件下滴定。滴定管尖端插入液面下滴定。为了避免滴定过程中亚硝酸挥发和分解，滴定时将滴定管尖端插入液面下约 $2/3$ 处，一次将大部分亚硝酸钠滴定液在搅拌下迅速加入，使其尽快反应，任何将滴定管尖端提出液面，用少量水淋洗尖端，再缓缓滴定。在最后一滴加入后，搅拌 $1\sim 5\text{min}$ ，再确定终点是否真正到达。这样可以缩短滴定时间，也不影响结果。

3. 终点指示方法：永停法。对乙酰氨基酚和片剂溶出度的测定可用：紫外分光光度法。

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