



解热镇痛抗炎药

阿司匹林（乙酰水杨酸）

复习旧课

1. 吗啡和哌替啶的作用、用途。
2. 吗啡和哌替啶的不良反应和禁忌症

。



下列哪些是吗啡的适应症

~~A 其他药无效的急性锐痛~~

~~B 癌症晚期的剧痛~~

C 分娩止痛

D 胃肠绞痛

E 神经痛

F 轻度癌痛

G 头痛、牙痛等慢性钝痛

哌替啶

阿托品

卡马西平

?)



导入新课



阿司匹林的发展史

1. 2000 多年前 古希腊 用柳树皮的液汁退热和止痛
2. 1829 年 欧洲化学家从柳树皮中提取到“水杨昔”
3. 1838 年 意大利科学家由水杨昔制成水杨酸
4. 1859 年 德国化学家以苯酚为原料合成水杨酸
5. 1875 年 水杨酸第一次用于治疗风湿病
6. 1893 年 德国拜耳公司 费利克斯·霍夫曼 用化学方法合成了“乙酰水杨酸”。
7. 1899 年 德国拜耳公司 出品水溶性白色阿司匹林药粉，不久又制成阿司匹林药片。德国化学家德瑞瑟将其命名为 Aspirin（阿司匹林）。
8. 1971 年 英国药学家约翰·万恩 获知并证实它还具有抑制血小板聚集，对防止血管栓塞有明显功效。



阿司匹林 (aspirin) 的作用

1. 解热
 2. 镇痛
 3. 抗炎抗风湿 (3-5g)
 4. 抑制血小板聚集 (50-100mg/d)
- 常用剂量 0.5g



作用机制

NSAIDs 共同的药理基础是抑制体内前列腺素（PG）合成。

PG 是一族不饱和脂肪酸，广泛存在于人和哺乳动物的各种重要组织和体液中，多种细胞都可合成 PG，它参与多种生理和病理作用。



前列腺素（PG）的作用

1. 合成和释放的增多，导致体温调定点的提高，体温升高（发热）。
2. PG 具有一定的致痛作用，同时还具有显著地提高痛觉神经末梢对其它致痛物质的敏感性。
3. PG 参与炎症反应，使血管扩张，通透性增加，引起局部充血、水肿和疼痛。



生理性刺激

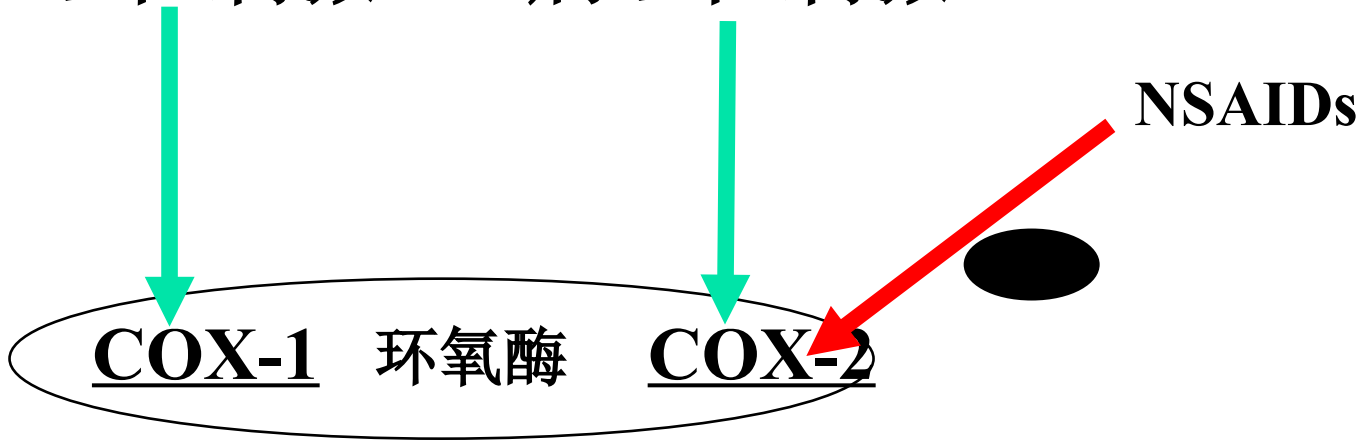
病理性刺激

COX-1

环氧酶

COX-2

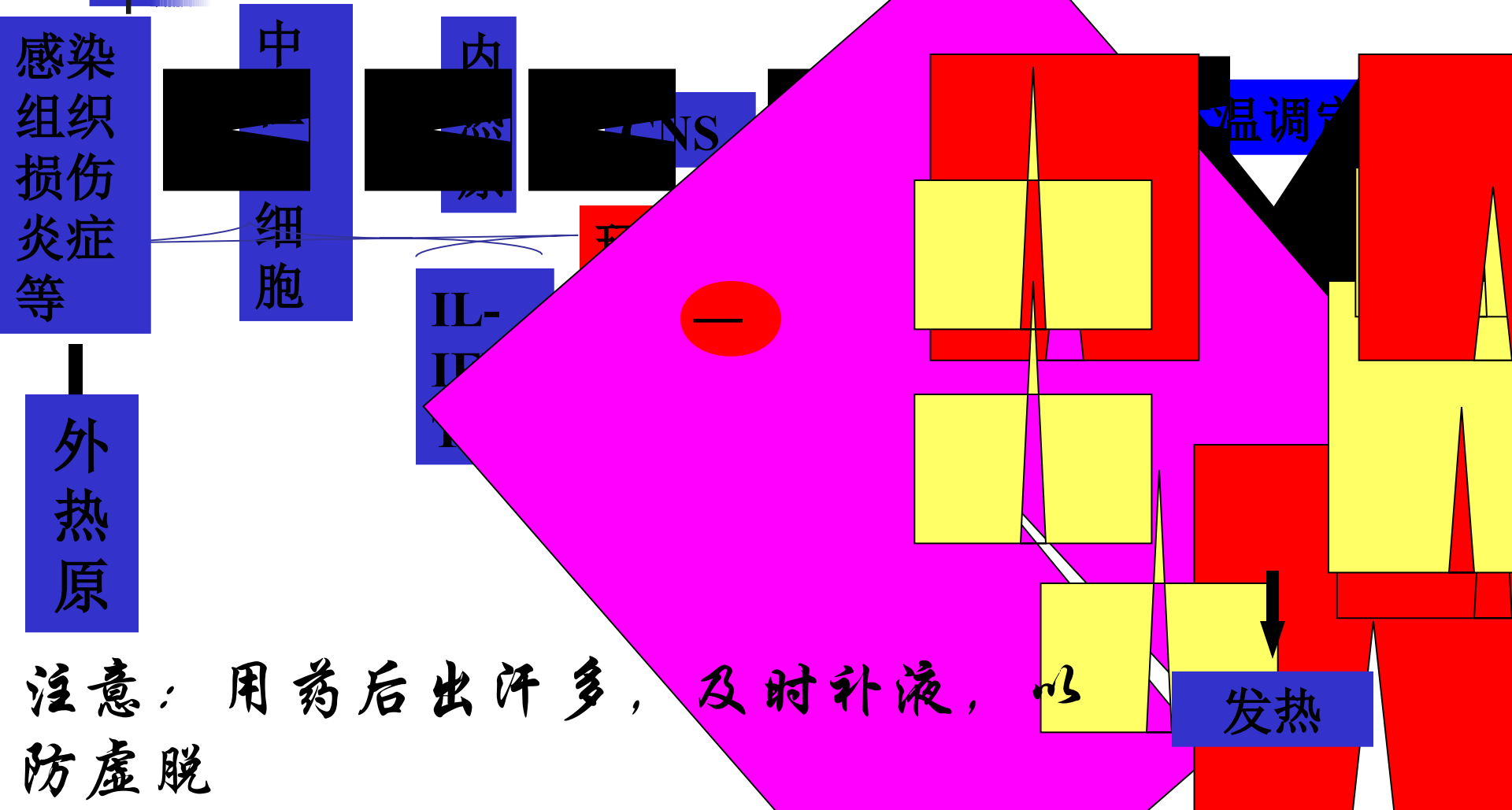
NSAIDs



解热机制：抑制下丘脑前列腺素合成

解热特点：降低发热病人体温，并恢复正常，而对正常体温无影响

1. 解热作用





1. 解热作用


正常体温：37°C — 下丘脑体温调节中枢（产、散热）

发热的利与弊

益处：提高机体防御机能，热型有助诊断。

害处：不适，消耗体力，致惊厥。

解热药：降低发热体温，须结合对因治疗。



有何不同？

阿司匹林的解热作用
氯丙嗪的降温作用

阿司匹林解热作用与氯丙嗪降温作用比较

阿司匹林

氯丙嗪

作用机制 抑制 PG 合成酶，减少
下丘脑 PG 的合成

抑制下丘脑体温调节中枢

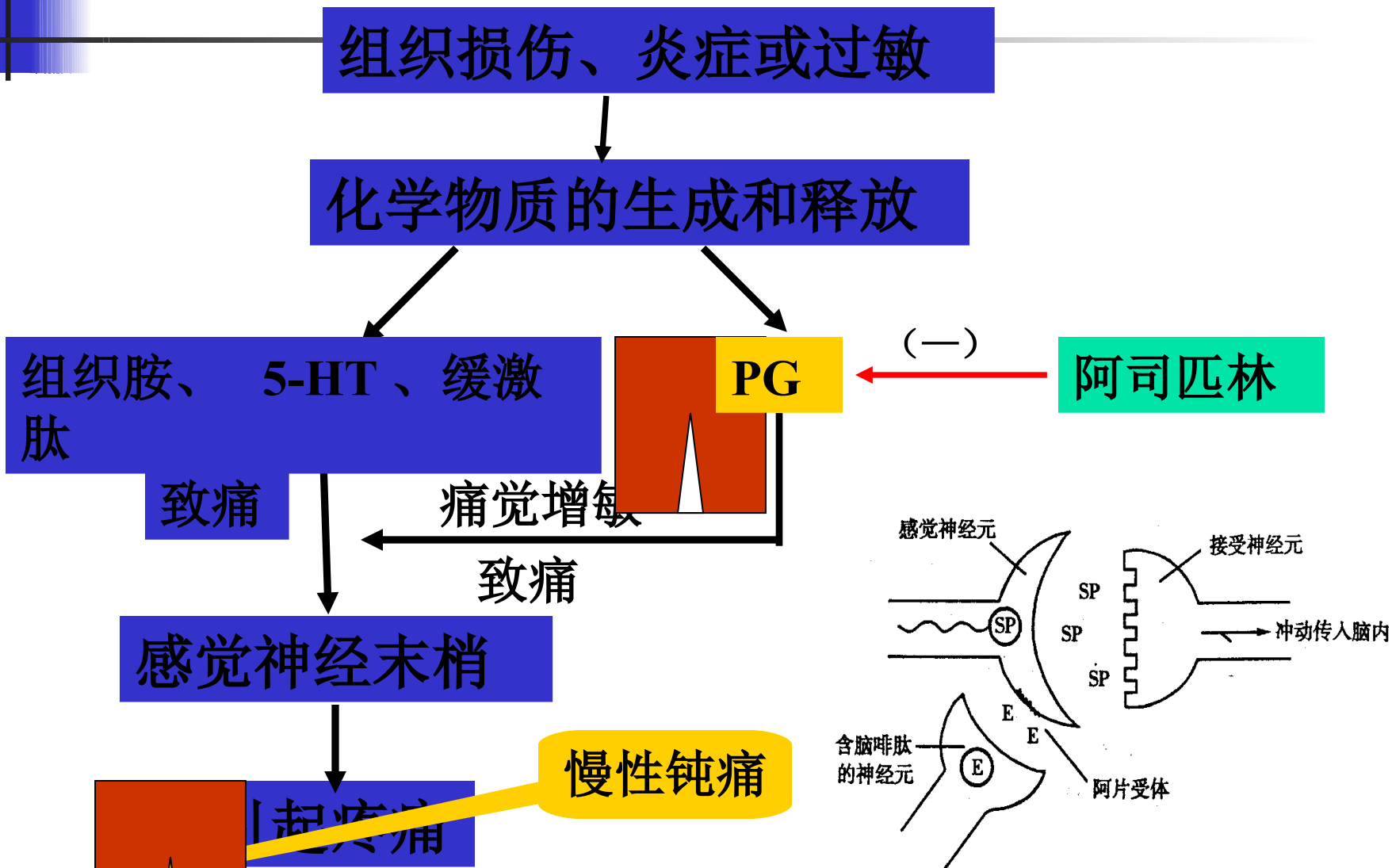
作用特点 只降发热体温
降至正常水平

配合物理降温，可降发热、
正常体温降至正常水平以下

用途 感冒发热、风湿热等

人工冬眠、低温麻
醉

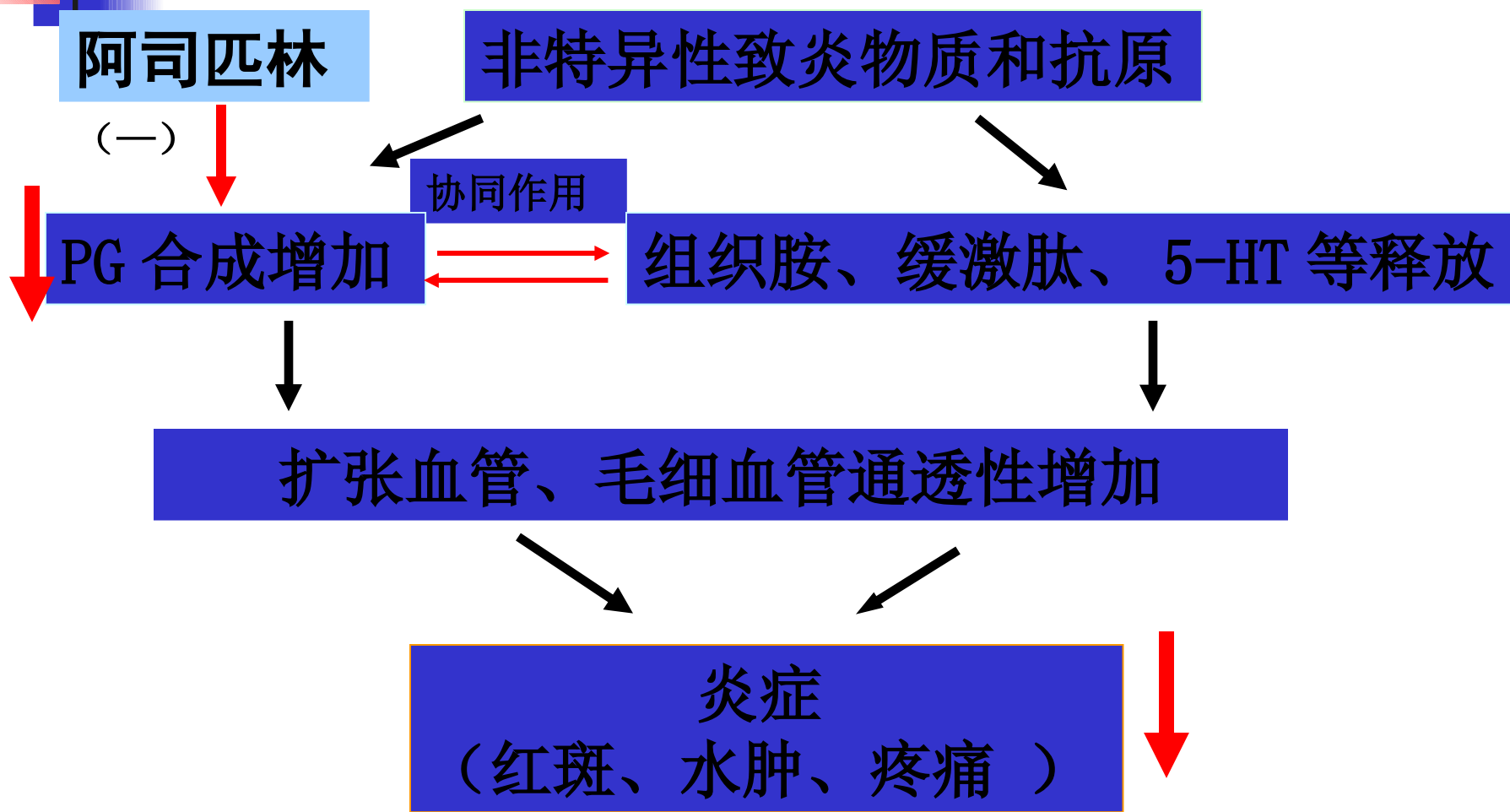
2. 镇痛作用




解热镇痛药与镇痛药镇痛作用比较

	镇痛药（吗啡）	解热镇痛药（阿司匹林）
作用部位	中枢	外周（主）
作用机制	激动阿片受体	抑制环加氧酶（COX），减少 PG 合成
镇痛特点	强大 任何疼痛都有效	中等强度 慢性钝痛
适应症	他药无效的急性锐痛	头痛、牙痛、关节痛等 慢性钝痛
不良反应	易成瘾，抑制呼吸	无成瘾性及呼吸抑制

3. 抗炎抗风湿（大剂量）





大剂量（3-5g）有明显消炎抗风湿，使急性风湿热患者退热，关节红、肿、痛缓解，血沉下降，是临床首选药之一。由于控制急性风湿热的疗效迅速而确实，故也可用于鉴别诊断。

对类风湿性关节炎也可迅速止痛，消退关节炎症，减轻关节损伤，目前仍是对症治疗首选药。

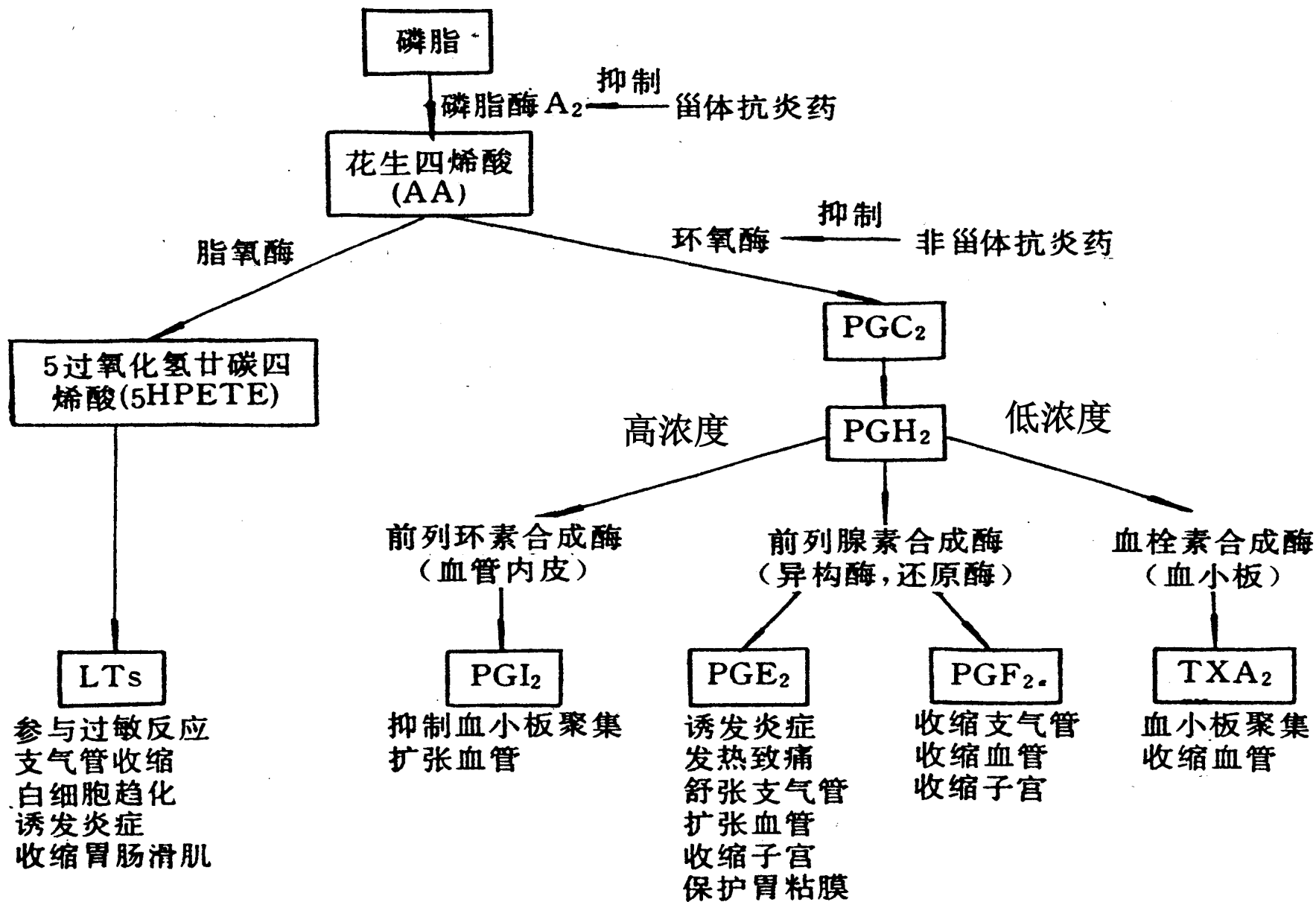


图 花生四烯酸的代谢途径及主要代谢产物的生物活性

4. 抑制血小板聚集，预防血栓形成（小剂量长疗程）

小剂量：抑制血小板中环氧酶（不可逆性抑制），血栓素（TXA₂）↓，防止血栓形成。

大剂量：抑制环氧酶（血管内皮），前列环素（PGI₂）↓，扩血管及抑制血小板聚集能力↓，促进血栓形成。

治疗：50-100mg/d，防止血栓形成。

(1) 用于缺血性心脏病（心绞痛、心梗）

不良反应



1. 胃肠道反应：（最常见）

原因：较大剂量刺激 CTZ；抑制 PGE₂ 合成

预防：注意适应症

饭后服

同服抗酸药

改用肠溶片（勿咬碎）

合用米索前列醇

2. 凝血障碍：出血或出血倾向

原因：抑制血小板聚集；长期用抑制凝血酶合成。

措施：严重肝损害、低凝血酶原血症，VitK 缺乏症忌用。术前 1～2 周停用。



用维生素 K
止血

3. 过敏反应

- 皮疹、休克；血管神经性水肿；“Aspirin哮喘”
- 原因：抑制 COX；白三烯（LT）增多
- 预防：过敏体质、哮喘者禁用
- “Aspirin哮喘”（肾上腺素无效），用糖皮质激素、抗组胺药

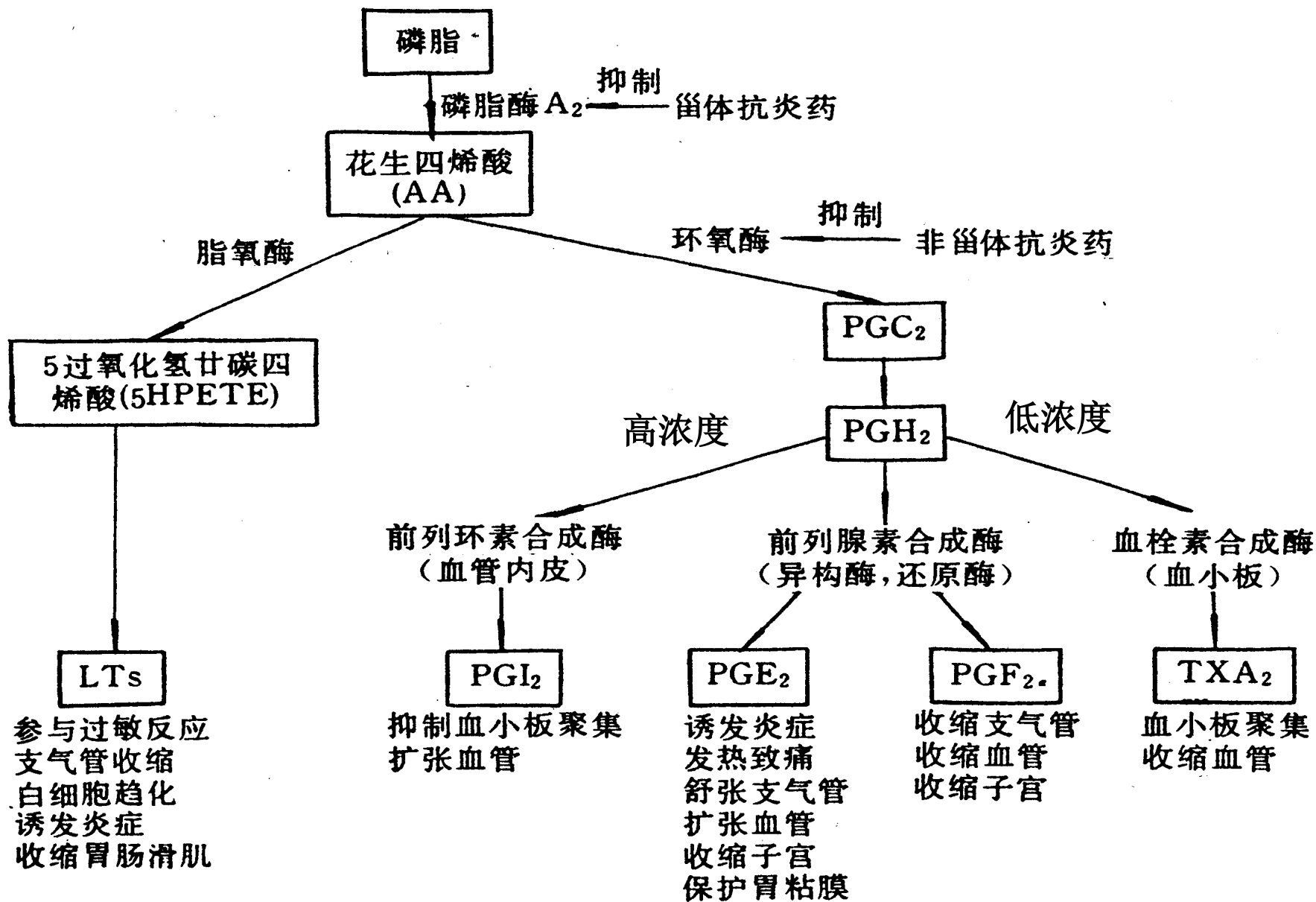


图 花生四烯酸的代谢途径及主要代谢产物的生物活性

4. 水杨酸反应： $> 5\text{g/d}$ 易发生

表现：头痛、恶心、呕吐、视力及听力减退等

处理：严重时，停药，碳酸氢钠静滴

5. 瑞夷（Reye）综合征

见肝功损伤合并脑病，病毒感染患儿易发生。

注意：病毒感染患儿不宜用阿司匹林，可用对乙酰氨基酚代替



小结

1. 作用

解热、镇痛、抗炎抗风湿

抑制血小板聚集

2. 用途

感冒发热、慢性钝痛等

风湿类风湿性关节炎的对症治疗

预防心肌梗死、脑栓塞等疾病的
发作



3. 不良反应

胃肠反应

凝血障碍

过敏反应

水杨酸反应

瑞夷综合征

苯胺类

对乙酰氨基酚（扑热息痛）

- 解热作用强，镇痛作用弱，几乎无抗炎抗风湿作用
- 非处方药，是很多感冒药的配伍成分，常用剂量较安全，胃肠反应轻，没有瑞夷综合征
- 但若剂量过大可致肝毒性。

其他类

布洛芬

解热、镇痛、抗炎作用强，胃肠反应轻



评价反馈

1. 阿司匹林的解热特点是

- A. 使发热病人的体温降至正常水平以下
- B. 使正常人体温降至正常水平以下
- C. 配合物理降温可使体温降至正常水平以下
- D. 使发热病人的体温降至正常

2. 阿司匹林的解热机制是

- A. 抑制下丘脑体温调节中枢
- B. 激动阿片受体
- C. 抑制下丘脑前列腺素合成和释放
- D. 抑制外周前列腺素合成和释放



3. 阿司匹林不宜用于

A. 感冒发热

B. 关节痛

~~C. 胃肠绞痛~~

D. 预防血栓形

成
4. 阿司匹林预防脑血管栓塞可采用

A. 大剂量突出治疗

B. 大剂量长疗程

~~C. 小剂量长疗程~~

D. 大剂量短疗程



5. 下列哪项不是阿司匹林的不良反应

A. 胃肠道反应

B. 水杨酸反应

C. 凝血障碍

~~D. 耳毒性~~

6. 服用阿司匹林引起的出血，应选用下列何药防治

A. Vc

B. VE

C. VB12

D. VK



作业

1. 列表比较阿司匹林解热作用和氯丙嗪的降温作用有何不同
2. 列表比较阿司匹林和吗啡的镇痛作用有何不同