

解热镇痛  
抗炎药



# 第十五章

## 解热镇痛抗炎药

01

第一节 基本药理作用

02

第二节 非选择性环氧化酶-2抑制药

03

第三节 选择性环氧化酶-2抑制药

04

第四节 抗痛风药



## 第十五章 解热镇痛抗炎药

### 重点难点

#### 重点

- 1.解热镇痛抗炎药的基本药理作用。
- 2.阿司匹林的药理作用、临床应用、不良反应及用药监护。

#### 难点

- 1.解热镇痛抗炎药的作用机制。
- 2.阿司匹林的抗凝机制。

# 第一节 概述

## 解热镇痛抗炎药

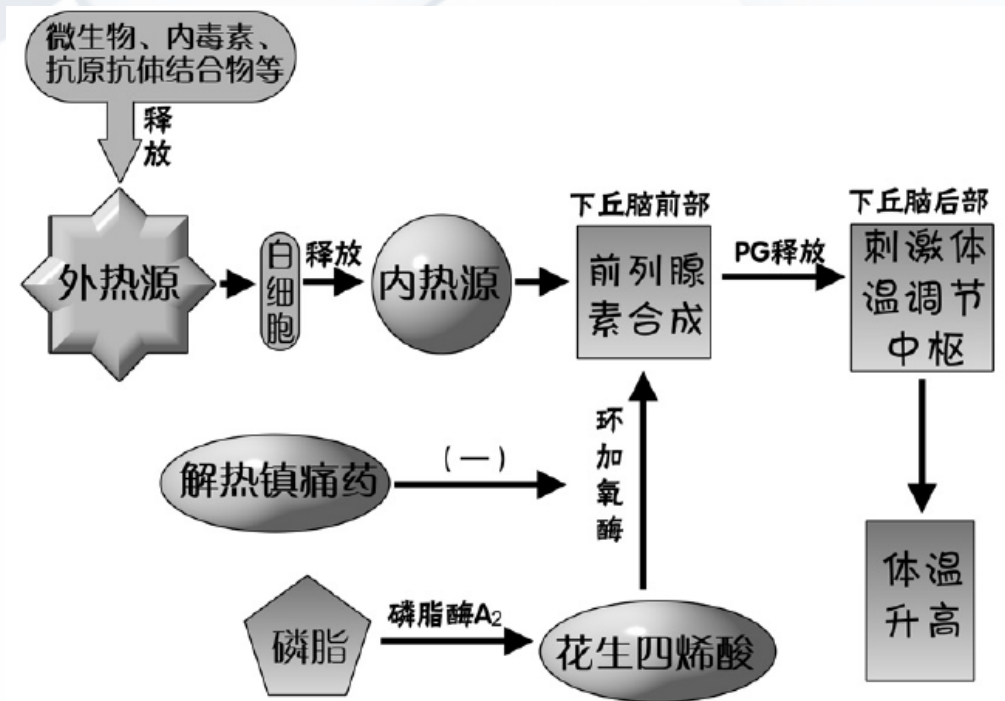


- 定义：一类具有解热、镇痛作用，绝大多数还兼有抗炎、抗风湿作用的药物。（又称为非甾体抗炎药）
- 基本作用机制：抑制体内环氧合酶（COX）的活性，减少前列腺素（PG）的生物合成。

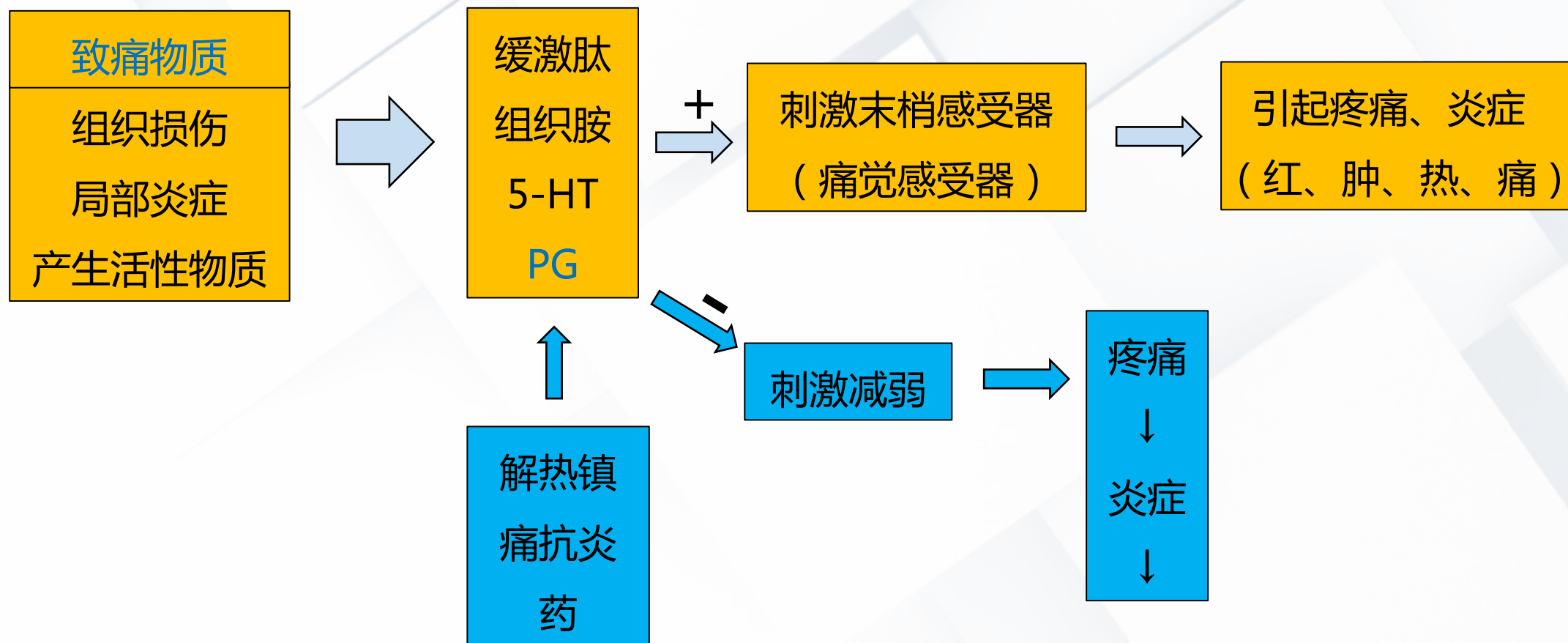
## （一）解热作用特点

### 【特点】：

- 1、只对发热体温有影响，而对正常体温无影响。
- 2、作用部位在中枢。通过抑制体温调节中枢，主要影响散热。



# 镇痛作用





# 解热镇痛抗炎药

---

## (二) 镇痛作用：

- 特点：**
- ① 中等程度镇痛
  - ② 镇痛不产生欣快感，无成瘾性
  - ③ 镇痛作用的部位在外周

## (三) 抗炎作用：

抑制炎症介质PG的合成，缓解症状，减轻炎症时的红肿热痛。

# 药物分类

水杨酸类：  
乙酰水杨酸  
(阿司匹林)  
代表药

苯胺类：  
对乙酰氨基酚  
(散列通)

丙酸类：  
布洛芬 (芬必得)

吲哚衍生物及类似物：  
吲哚美辛 (消炎痛)

其他类：  
吡罗昔康和  
美洛昔康

吡唑酮类：  
保泰松



## 第二节 非选择性环氧化酶抑制药

乙酰水杨酸（阿斯匹林，Aspirine）

### 体内过程

- 1、PO易吸收
- 2、经肝代谢，肾排泄
- 3、分布广，可通过血脑屏障及胎盘屏障
- 4、尿液的pH变化对其排泄影响很大

即：尿液呈酸性时有利于药物再吸收，使排出减少；

尿液呈碱性时使药物再吸收减少，加速排泄。

# 药理作用及临床应用

## 1、解热镇痛

有较强的解热镇痛作用，常与其他解热镇痛药配成复方，用于感冒发烧、头痛、牙痛、肌肉痛、关节痛、痛经、神经痛和癌性疼痛等轻中度疼痛。



# 药理作用及临床应用

## 2、抗炎抗风湿

抗炎、抗风湿作用也较强，且随剂量增加而增强，**大剂量**（3-5g/日，为最大耐受剂量）有明显抗炎抗风湿作用，为抗风湿病的主要药物，仍是目前用于风湿性及类风湿性关节炎的**首选药**，可用于鉴别诊断急性风湿热。

类风湿关节炎X线



## 药理作用及临床应用

### ● 3、抗血栓



抗血栓

小剂量阿司匹林，不可逆性抑制血小板COX，减少血小板中血栓素A<sub>2</sub> (TXA<sub>2</sub>) 合成而抑制血小板聚集。

临床上采用小剂量（75 ~ 150mg/d）的阿司匹林，防止血栓的形成，治疗缺血性心肌病和心肌梗死等疾病。



## 不良反应

- 1 胃肠道反应：呕吐，恶心等，可致溃疡
- 2 凝血障碍：延长出血时间，可用维生素K预防
- 3 过敏反应：阿司匹林哮喘，导致白三烯增加引起
- 4 水杨酸反应：头痛，眩晕，可惊厥，大剂量产生
- 5 瑞夷综合症：肝损害和脑病，多发儿童和青少年

为你扬名义！

小结：

阿司匹林（乙酰水杨酸）

| 药物   | 作用               | 临床应用                  | 不良反应                                                        | 药物相互作用                                                                                  |
|------|------------------|-----------------------|-------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------|
| 阿司匹林 | 解热               | 感冒发热                  | 胃肠道反应<br>凝血障碍<br>变态反应<br>水杨酸反应<br>瑞夷综合征<br>对肾脏的影响<br>药物相互作用 | 与香豆素类口服抗凝药合用易引起出血；与磺酰脲类降血糖药合用易引起低血糖反应；与糖皮质激素合用易诱发溃疡和胃肠出血；妨碍呋塞米、青霉素、甲氨蝶呤从肾小管分泌，增加各自血药浓度。 |
|      | 镇痛               | 慢性钝痛和癌性镇痛<br>现在少用     |                                                             |                                                                                         |
|      | 抗炎抗风湿            | 为风湿性关节炎和类风湿性关节炎的首选药   |                                                             |                                                                                         |
|      | 抑制血小板聚集<br>(小剂量) | 防治血栓栓塞性疾病<br>目前临床主要用途 |                                                             |                                                                                         |
|      |                  | 痛风、胆道蛔虫病              |                                                             |                                                                                         |

# 苯胺类

## 对乙酰氨基酚（扑热息痛、醋氨酚）

### 药理作用与临床应用

1. **解热强**，镇痛弱作用缓和而持久
2. **几乎无抗炎抗风湿作用**
3. 临床主要用于感冒发热，中度以下疼痛
4. 不良反应少（**过量急性中毒可致肝损伤**）





# 吡唑酮类

## 保泰松 羟基保泰松

### 药理作用特点

1. 解热镇痛作用弱, 抗风湿作用强

主要用于风湿性及类风湿性关节炎

2. 保泰松可减少肾小管对尿酸盐类的重吸收

用于急性痛风

3. 血浆蛋白结合率高, 不良反应较多且严重



# 其他有机酸类

## 一. 吲哚乙酸类

吲哚美辛（消炎痛）

特点：

- 1、为最强的PG合成酶抑制药之一，有显著解热、镇痛、抗炎、抗风湿作用；
- 2、只对炎性疼痛有效，对非炎性疼痛无效；
- 3、不良反应多，发生率35-50%；
- 4、仅用于其他药物不能耐受或疗效不佳的风湿性及类风湿性关节炎；
- 5、吲哚美辛与阿司匹林有交叉过敏性，阿司匹林过敏者不宜使用；与氨苯蝶啶合用可引起肾功能损伤。



# 其他有机酸类

---

## 二.灭酸类

甲芬那酸 氯芬那酸 双氯芬酸

主要用于治疗风湿性和类风湿性关节炎。

## 三.丙酸类

布洛芬

解热作用较阿司匹林弱，镇痛、抗炎作用很强对胃肠道刺激小，病人易耐受，主要用于风湿性、类风湿性关节炎和骨关节炎，也可用于一般解热镇痛。

## 四.昔康类

吡罗昔康

半衰期长，用药剂量小

## 使用解热镇痛药时应注意：

- 1、不要见热就退
- 2、是对症治疗药，在对症治疗时要找到内因
- 3、对阿司匹林过敏的患者慎用
- 4、用于解热连续使用不超过3天,用于止痛不超过5天





## 第三节 选择性环氧化酶-2抑制药

### 塞来昔布

【药理作用与临床应用】具有抗炎、镇痛和解热作用。用于风湿性、类风湿关节炎和骨关节炎的治疗，也可用于手术后镇痛、牙痛、痛经，同时还可以用来治疗家族性腺瘤性息肉。

【不良反应】胃肠道不良反应、出血和溃疡发生率均较其他非选择性非甾体抗炎药低。但其他非甾体抗炎药能引起的水肿、多尿和肾损害也有可能发生；心血管系统不良反应较为严重，长期使用塞来昔布可能增加严重心血管血栓性不良事件、心肌梗死和卒中的风险，有血栓形成倾向的患者需慎用；磺胺类过敏的患者禁用。

## 第三节 选择性环氧化酶-2抑制药

### 尼美舒利

尼美舒利是一种新型非甾体抗炎药。其具有抗炎、镇痛和解热作用，比布洛芬、对乙酰氨基酚其抗炎作用强，副作用较小。但是在儿童发热用药的选择上需慎用尼美舒利，并禁止其口服制剂用于12岁以下儿童。常用于类风湿关节炎和骨关节炎、腰腿痛、牙痛、痛经的治疗。胃肠道不良反应少而轻微。



## 第四节 抗痛风药

### 痛风产生的原因

- 痛风是因血尿酸增高及尿酸盐结晶在关节和组织沉积而引起的一组综合症，它包括关节炎、痛风石、泌尿道尿酸性结石及痛风性肾病等。
- 引起痛风的原因为体内嘌呤代谢的最终产物—尿酸过剩，高于正常值。这可因尿酸氧化酶（或尿酸酶）的缺乏使尿酸不能被氧化而增多；亦可因肾脏功能不全使尿酸排泄减少，两者均可造成高尿酸血症。





## 第四节 抗痛风药

### 抗痛风药的分类

- 针对痛风的不同临床阶段，抗痛风药可分为控制急性关节炎症状和抗高尿酸血症两大类药物。
- 控制痛风性关节炎症状的药物主要包括秋水仙碱、非甾体类抗炎药和糖皮质激素等；
- 抗高尿酸血症类药物主要包括抑制尿酸生成药（如别嘌醇，非布司他）和促进尿酸排出药（如苯溴马隆和丙磺舒等）。

## 第四节 抗痛风药

### 一、抑制尿酸生成药

#### 别嘌醇

别嘌醇使尿酸生物合成受阻，血浆中尿酸浓度降低，尿中排出减少，并能使痛风患者组织内的尿酸结晶重新溶解，使痛风症状得到缓解，多用于慢性痛风。

#### 非布司他

非布司他为选择性黄嘌呤氧化酶抑制剂，可通过降低血尿酸盐浓度而发挥作用，是一种治疗痛风的新药。与别嘌醇相比，非布司他可快速降低血尿酸水平，尤其对于存在轻中度肾功能不全的患者无需调整剂量，且无明显不良反应。





## 第四节 抗痛风药

### 二、促进尿酸排泄药

#### 丙磺舒

丙磺舒因没有镇痛及抗炎作用，不适用于急性痛风。口服吸收完全，不良反应少见。

#### 苯磺吡酮

苯磺吡酮又名硫氧吡酮、苯磺保泰松。可抑制肾小管对尿酸的再吸收，促进尿酸的排泄，降低血尿酸水平。此外，尚可抑制血小板聚集，增加血小板存活时间，并有微弱的抗炎和镇痛作用。用于慢性痛风性关节炎和高尿酸血症，动脉血栓性疾病的防治。减缓或预防痛风结节的形成和关节的痛风病变。常见不良反应有恶心、呕吐、腹痛、皮疹、咽痛、肝损害。

## 第四节 抗痛风药

### 二、促进尿酸排泄药

#### 苯溴马隆

苯溴马隆(苯溴香豆素)为白色或淡黄色结晶性粉末，无味。本品是苯并呋喃衍生物，能抑制肾小管对尿酸的再吸收，促进尿酸排泄，从而降低血中尿酸的浓度。因其不会阻挠嘌呤核苷酸代谢，适用于长期治疗高尿酸血症及痛风病。



### 三、控制急性关节炎症状类药物

#### 秋水仙碱

秋水仙碱对急性痛风性关节炎有选择性抗炎作用。秋水仙碱可缓解急性期疼痛，用药后可在12小时内缓解关节红、肿、热、痛，对一般性疼痛及其他类型关节炎无效。不良反应多见，主要是胃肠道反应如恶心、呕吐、腹痛、腹泻。中毒时出现水样腹泻及血便、脱水、休克；对肾及骨髓也有损害作用。

