

苯佐卡因的制备

苯佐卡因，学名：对氨基苯甲酸乙酯，是一种局部麻醉药。它通过抑制神经末梢的钠离子通道，从而阻断疼痛信号的传递。在临床上，苯佐卡因常被用于治疗各种轻度至中度的疼痛，如牙痛、术后疼痛以及皮肤表面的烧伤或割伤。

苯佐卡因的化学结构式为 COC(=O)c1ccccc1Nc2ccccc2。其合成方法通常涉及对氨基苯甲酸与乙醇在催化剂作用下进行酯化反应。

在实验室条件下，苯佐卡因的制备步骤如下：

1. 将对氨基苯甲酸（约 10 克）加入到装有搅拌器的圆底烧瓶中。
2. 向烧瓶中加入乙醇（约 50 毫升）。
3. 在室温下搅拌数小时，直至溶液完全溶解。
4. 加入适量的浓硫酸作为催化剂。
5. 在室温下继续搅拌数小时。
6. 反应完成后，将混合物倒入冰水浴中，析出白色固体。
7. 用布氏漏斗过滤，洗涤固体产物，直至洗涤液呈中性。
8. 将干燥后的固体产物称重，即得苯佐卡因成品。

需要注意的是，苯佐卡因具有一定的毒性，过量使用可能导致中枢神经系统抑制、呼吸抑制等不良反应。因此，在使用时必须严格按照医嘱，避免滥用。

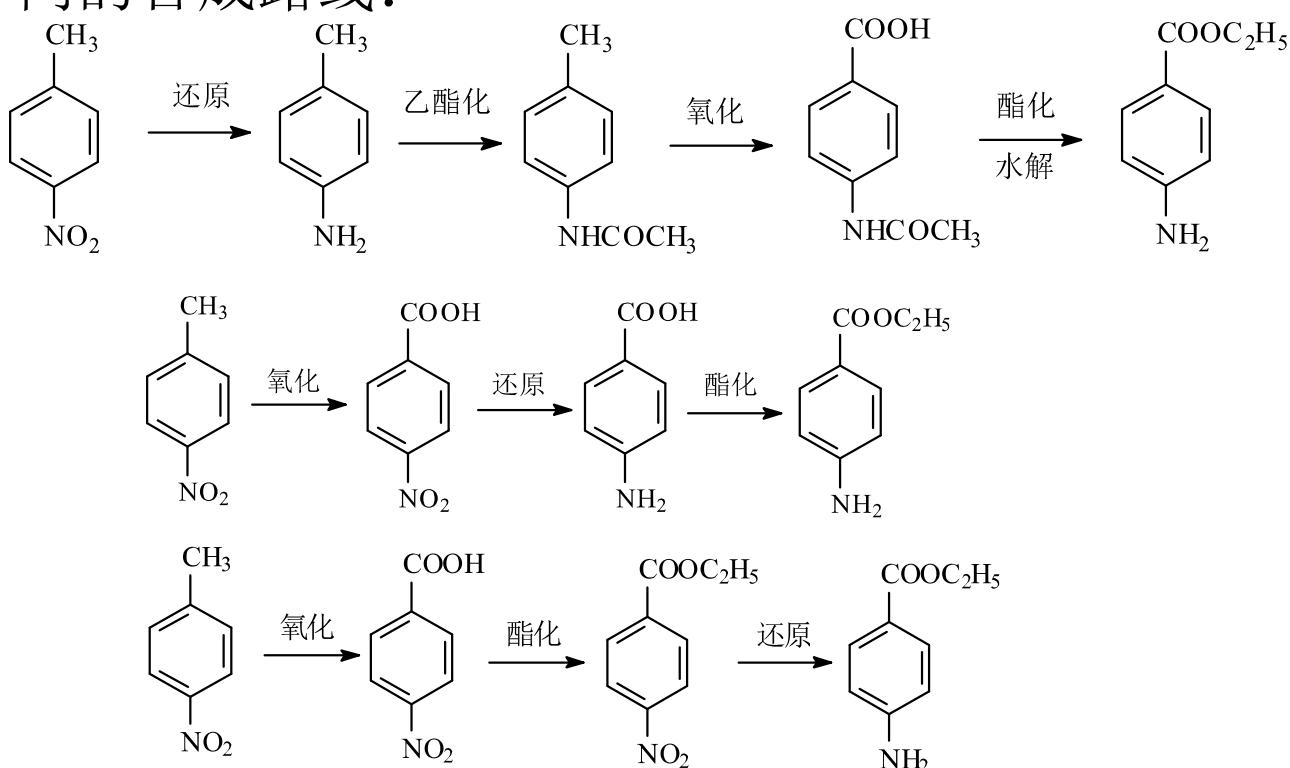
一、实验目的

- 学习多步聚合成制备苯佐卡因的原理和方法。
- 练习多步聚合成的实验操作技术。
- 巩固回流、过滤和结晶等基本操作技术。

二、实验原理

- 苯佐卡因（Benzocaine）是对氨基甲酸乙酯的俗称，可用作局部麻醉剂（Local Anesthetics）或止痛剂（Painkiller）。

苯佐卡因有多种合成方法。若以对硝基甲苯为原料可有三种不同的合成路线：



三、实验试剂与仪器

对硝基苯甲酸: 4g (0.02mol) ; 锡粉: 9 g (0.08mol) ;
浓HCl: 20mL (0.25mol) ; 浓氨水; 冰醋酸; 对氨基苯甲酸 (自制) : 2g (0.145mol) ; 无水乙醇: 20mL (0.34mol) ; 浓硫酸: 2mL;
 Na_2CO_3 粉末; 10% Na_2CO_3 溶液
三口烧瓶; 圆底烧瓶; 滴液漏斗; 回流冷凝管; 电热套;
磁力搅拌器; 布氏漏斗; 表面皿; 烧杯; 量筒

四、实验步骤

1.还原反应

在100 mL三口烧瓶上安装回流冷凝器和滴液漏斗。三口烧瓶中加入4g对硝基苯甲酸、9g锡粉和磁力搅拌子，滴液漏斗中加入20mL浓HCl。开动磁力搅拌，从滴液漏斗中滴加浓HCl，反应立即开始。如有必要可稍稍加热以维持反应正常进行（反应液中锡粉逐渐减少）。约20~30min后反应接近终点，反应液呈透明状。

稍冷后，将反应液倾入250 mL烧瓶中。待反应液冷至室温后，在不断搅拌下慢慢滴加浓氨水，使溶液刚好呈碱性，注意总体积不要超过55 mL，可加热浓缩。向滤液中小心地滴加冰醋酸，即有白色晶体析出。继续滴加少量冰醋酸，则有更多的固体析出，用蓝色石蕊试纸检验直到呈酸性为止。在冷水浴中冷却后抽滤得白色固体，晾干后称重，产量约为2 g。

2. 酯化反应

在100 mL三口烧瓶中加入2g对氨基苯甲酸、20mL无水乙醇和2mL浓硫酸。将混合物充分摇匀，投入沸石，安上回流冷凝管，在电热套中加热回流1h，反应液呈无色透明状。

趁热将反应液倒入盛有85 mL水的烧杯中。溶液稍冷后，慢慢加入Na₂CO₃固体粉末，边加边用玻璃棒搅拌，使Na₂CO₃粉末充分溶解。当液面上有少许白色沉淀出现时，再慢慢滴加10% Na₂CO₃溶液，将溶液的pH值调至9左右。所得固体产品用布氏漏斗抽滤。晾干后称重。产量为1~2克。

五、数据处理

苯唑卡因的实际值和理论值，并计算分步转化率和最终转化率。

六、思考题

1. 试提出其它合成苯佐卡因的路线并比较它们的优缺点。
2. 酯化反应为何先用Na₂CO₃粉末中和，再用10% Na₂CO₃溶液中和反应用？