

2009年西药师辅导：药物分析肾上腺素能药物（1）执业药师考试 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/644/2021_2022_2009_E5_B9_B4_E8_A5_BF_c23_644769.htm id="deng" class="kuang"> 肾上腺素能药物包括肾上腺素能激动剂和肾上腺素能拮抗剂二类。根据生理效应的不同，肾上腺素能受体可分为 α 受体和 β 受体， α 受体又可分为 α_1 和 α_2 亚型， β 受体又可分为 β_1 和 β_2 亚型。一、肾上腺素能激动剂 肾上腺素能激动剂是一类使肾上腺素能受体兴奋，产生肾上腺素样作用的药物。也称为拟肾上腺素药。按化学结构分类可分为苯乙胺类和苯异丙胺类。（一）苯乙胺类肾上腺素能激动剂来源：考试大 肾上腺素（Epinephrine；Adrenaline）是肾上腺髓质分泌的主要神经递质，为最早发现的肾上腺素能激动剂。进一步研究发现，交感神经兴奋时，神经末梢和髓质释放的主要递质是去甲肾上腺素（Noradrenaline）。去甲肾上腺素在酶的作用下，转变为肾上腺素。以后又发现了多巴胺（Dopamine），多巴胺是体内生物合成去甲肾上腺素和肾上腺素的前体。三者都是内源性物质，对传出神经系统的功能起着主要的介导作用。他们的结构中都含有苯乙胺结构，苯环的3和4位有羟基取代，因此称为儿茶酚胺类。对其构效关系的研究，认识到苯乙胺结构是本类药物的基本结构。通过对苯环上取代基、侧链氨基上取代基的改变，发展了多种用于临床的肾上腺素能激动剂。例如：去氧肾上腺素（Phenylephrine）、异丙肾上腺素（Isoprenaline）、克仑特罗（Clenbuterol）、沙丁胺醇（Sulbutamol）、氯丙那林（Clorprenaline）等。1.肾上腺素（Epinephrine；Adrenaline）化学名：（R）-4-[2-（甲氨基

)-1-羟基乙基]-1, 2-苯二酚 性质：（1）结构中有一个手性碳原子，为R构型，具左旋光性。R（-）-异构体的作用强于S（+）-异构体。肾上腺素水溶液在室温放置或加热后，易发生消旋化反应，使活性降低。pH4以下消旋化反应速度较快。

（2）稳定性：分子结构中具有儿茶酚（邻苯二酚）结构，性质不稳定，接触空气或受日光照射，极易被氧化变质，生成红色的肾上腺素红，进一步聚合成棕色多聚物。碱性条件下加速氧化，中性及酸性条件下，也易发生氧化，但相对碱性下较稳定。在相同条件下，温度越高，氧化速度越快。金属离子催化此反应。制备注射剂时应加抗氧剂，避免与空气接触并避光保存。去甲肾上腺素、异丙肾上腺素、多巴胺等分子结构中也具有儿茶酚结构，也易被氧化变质。（3）溶于稀盐酸后，与过氧化氢试液反应被氧化，显血红色。（4）在pH3-3.5时与碘试液反应，再加硫代硫酸钠试液使过量碘的颜色消退，溶液呈红色。（5）与三氯化铁试液反应，即显翠绿色（酚羟基与铁离子络合呈色）；再加氨试液后变为紫色，最后变为紫红色。用途：肾上腺素对 α 和 β 受体均有较强的激动作用，主要用于治疗过敏性休克、心脏骤停的急救、支气管哮喘等。肾上腺素口服无效，常用剂型为盐酸肾上腺素注射液。2.酒石酸去甲肾上腺素（Noradrenaline Bitartrate）化学名：（R）-4-（2-氨基-1-羟基乙基）-1, 2-苯二酚重酒石酸盐一水合物百考试题 - 全国最大教育类网站(www.Examda.com) 性质：（1）分子中氨基的 β 位碳原子为不对称碳原子，有一对旋光异构体，临床上所使用的去甲肾上腺素是其R-构型左旋异构体，左旋体活性比右旋体大约27倍。去甲肾上腺素水溶液在室温放置或加热后，易发生消旋化

反应，使活性降低。（2）分子结构中具有儿茶酚（邻苯二酚）结构，与肾上腺素类似，性质不稳定，接触空气或受日光照射，极易被氧化变质，生成红色的去甲肾上腺素红，进一步聚合成棕色多聚物。制备注射剂时应加抗氧剂，避免与空气接触并避光保存。（3）去甲肾上腺素在酒石酸氢钾饱和溶液中（pH3~3.5），比肾上腺素稳定，几乎不被碘氧化，与碘试液反应后，再加硫代硫酸钠试液使过量碘的颜色消退，溶液为无色或仅显微红色或淡紫色。（与肾上腺素、异丙肾上腺素相区别）。（4）分子结构中具有酚羟基，与三氯化铁试液反应，即显翠绿色；再加入碳酸钠试液即显蓝色，最后变成红色。用途：去甲肾上腺素主要激动 α 受体，又很强的收缩血管作用，临床主要用于治疗各种休克。

3. 盐酸异丙肾上腺素（Isoprenaline Hydrochloride）化学名：4-[(2-异丙氨基-1-羟基)乙基]-1,2-苯二酚盐酸盐 性质：（1）分子结构中氨基的 β 位碳原子为不对称碳原子，有一对旋光异构体，临床上以其消旋体供药用。其R(-)-异构体的作用强于S(+)-异构体。（2）分子结构中具有儿茶酚（邻苯二酚）结构，与肾上腺素类似，性质不稳定，接触空气或受日光照射，极易被氧化变质，生成红色的异丙肾上腺素红，进一步聚合成棕色多聚物。制备注射剂时应加抗氧剂，避免与空气接触并避光保存。（3）与碘试液反应后，再加硫代硫酸钠试液使过量碘的颜色消退，溶液为淡红色。（4）分子结构中具有酚羟基，与三氯化铁试液反应，即显深绿色；再加入碳酸钠试液即变为蓝色，然后变成红色。用途：异丙肾上腺素为 β 肾上腺素能受体激动剂。有舒张支气管作用和增强心肌收缩力，临床用于支气管哮喘和抗休克等。

4. 盐酸多巴胺

(Dopamine Hydrochloride) 化学名：4-(2-氨基乙基)-1,2-苯二酚盐酸盐 性质：(1) 分子结构中具有儿茶酚(邻苯二酚)结构，与肾上腺素类似，性质不稳定，接触空气或受日光照射，色渐变深。(2) 盐酸多巴胺水溶液与三氯化铁试液反应显墨绿色；加氨溶液转变成紫红色。(3) 与三硝基苯酚试液反应，生成多巴胺三硝基苯酚盐结晶，熔点约为200

。用途：多巴胺为 α 和 β 受体激动剂；多巴胺受体激动剂。临床用于各种类型休克。5.盐酸克仑特罗(Clenbuterol Hydrochloride) 化学名： α -(叔丁氨基)甲基-4-氨基-3,5-二氯苯甲醇盐酸盐来源：考试大 性质：(1) 分子结构中具有芳伯氨基，显芳香第一胺类的鉴别反应(重氮化-偶合反应)。(2) 克仑特罗可被20%硫酸制高锰酸钾的饱和溶液氧化，生成的3,5-二氯-4-氨基苯甲醛，与2,4-二硝基苯胼的高氯酸溶液反应，生成胼的沉淀。用途：为 β_2 受体激动剂，主要用于支气管哮喘。

6.硫酸沙丁胺醇(Salbutamol Sulfate) 化学名：1-(4-羟基-3-羟甲基苯基)-2-(叔丁氨基)乙醇硫酸盐 性质：(1) 分子结构中具有酚羟基，与三氯化铁试液反应显紫色；再加碳酸钠试液生成橙黄色混浊。

(2) 沙丁胺醇溶在弱碱性的硼砂溶液中，可被铁氰化钾氧化，氧化产物与4-氨基安替比林生成橙红色缩合物。用途：为 β_2 受体激动剂，主要用于支气管哮喘。口服有效，作用时间长。

7.盐酸氯丙那林(Clorprenaline Hydrochloride) 化学名： α -[(1-甲基乙基)氨基]甲基-2-氯苯甲醇盐酸盐 用途：为 β_2 受体激动剂，主要用于支气管哮喘。

8.硫酸特布他林(Terbutaline Sulfate) 化学名：($\pm$)- α -(叔丁氨基)甲基-3,5-二羟基苯甲醇硫酸盐 用途：为 β_2 受体激动剂，主

要用于支气管哮喘。 9.盐酸去氧肾上腺素（ Phenylephrine Hydrochloride ）来源：考试大 化学名：（ R ） - （ - ） - α - [（ 甲氨基 ） 甲基] - 3 - 羟基苯甲醇盐酸盐 用途：为 α 受体激动剂，用于治疗休克。 更多信息请访问：执业药师网校 百考试题论坛 百考试题在线考试系统 百考试题执业药师加入收藏 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