

2009年西药师辅导：药物分析肾上腺素能药物（2）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_644770.htm id="song" class="chao">（二）

苯异丙胺类肾上腺素能激动剂 临床常用的药物有麻黄碱

（Ephedrine）、伪麻黄碱（Pseudoephedrine）、间羟胺（Metaraminol）、甲氧明（Methoxamine）等。1.盐酸麻黄碱（Ephedrine Hydrochloride）化学名：（1R，2S）-2-甲氨基-苯丙烷-1-醇盐酸盐 麻黄碱是从草麻黄等植物中分离出的一种生物碱。结构中有两个手性碳原子，有四个光学异构体，手性碳原子的构型分别为（1R，2S）、（1R，2R）、（1S，2R）、（1S，2S）。四个光学异构体中只有（-）-麻黄碱（1R，2S）有显著活性。（+）-伪麻黄碱（1S，2S）的作用比麻黄碱弱，常用于复方感冒药中用于减轻鼻出血等。性质：（1）麻黄碱与一般生物碱的不同处为氮原子在侧链上，结构属芳烃胺类。与一般生物碱的性质不完全相同。碱性较强；与多种生物碱试剂不能生成沉淀。（2）分子中不含儿茶酚结构，性质较稳定。（3）麻黄碱在碱性溶液中与硫酸铜试液反应，生成蓝紫色的配位化合物，加乙醚振摇，醚层显紫红色，水层呈蓝色。用途：麻黄碱对 α 和 β 受体都有激动作用，具有松弛支气管平滑肌，收缩血管、兴奋心脏等作用。临床主要用于支气管哮喘，过敏反应、低血压等。2、盐酸伪麻黄碱（Pseudoephedrine Hydrochloride）化学名：（1S，2S）-2-甲氨基-苯丙烷-1-醇盐酸盐 用途：作用比麻黄碱弱，常用于减轻鼻及支气管充血，过敏反应等。3.盐酸甲氧明（Methoxamine Hydrochloride）化学名： α -（1-氨基乙基

) -2, 5-二甲氧基苯甲醇盐酸盐 性质：盐酸甲氧明水溶液在加热时可被氧化分解，制备注射剂灭菌时应注意控制温度。用途：为 α 受体激动剂。有收缩血管、升高血压作用。临床用于低血压的急救等。

4. 重酒石酸间羟胺 (Metaraminol Bitartrate) 化学名：(-)- α -(1-氨基乙基)-3-羟基苯甲醇重酒石酸盐 用途： α 受体激动剂。临床用于低血压和休克等。

(三) 肾上腺素能激动剂的构效关系 肾上腺素能激动剂通过与肾上腺素受体结合形成药物-受体复合物发挥药效，药物的化学结构必须与受体的活性部位相适应。此类药物的构效关系简述如下：

1. 具苯乙胺基本结构，任何碳链的延长和缩短都会使活性降低。
2. 苯乙胺类侧链氨基的 β 位有羟基取代，有一个手性碳原子 (多巴胺除外)，存在旋光异构体，以 R-构型异构体具有较大的活性。例如去甲肾上腺素 R-构型左旋异构体活性比 S-构型右旋体强约 27 倍。
3. 苯环 3, 4-二羟基 (儿茶酚结构) 的存在可显著增强 α 、 β 活性，但是此类药物口服后，3 位羟基迅速被儿茶酚-O-甲基转移酶 (COMT) 甲基化而失活，因此肾上腺素、去甲肾上腺素不能口服。如改变为 3, 5-二羟基 (例如特布他林)，或将 3-羟基用氯取代 (例如克仑特罗) 口服均有效。
4. 侧链氨基上的烷基大小与此类药物的受体选择性有密切关系。在一定范围内，N-取代基越大，例如为异丙基或叔丁基时，对 β 受体的亲和力越强。例如异丙肾上腺素、克仑特罗等，临床主要用于支气管哮喘。
5. 侧链氨基 α 位碳原子上引入甲基，为苯异丙胺类，由于甲基的位阻效应可阻碍单胺氧化酶 (MAO) 脱氨氧化的失活作用，使药物作用时间延长。

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

师加入收藏 相关推荐：2009年西药师辅导：药物分析肾上腺素能药物（1）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