

2010年西药师药物化学辅导：药物化学镇痛药（5）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\\_ti2020/645/2021\\_2022\\_2010\\_E5\\_B9\\_B4\\_E8\\_A5\\_BF\\_c23\\_645783.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/645/2021_2022_2010_E5_B9_B4_E8_A5_BF_c23_645783.htm)

六、内源性阿片样肽类 1973年以实验证实了鼠脑中存在阿片受体，提示体内存在内源性配体。之后从哺乳动物脑中分离出两个具有吗啡样镇痛活性的多肽，称为脑啡肽（Enkephalin），即亮氨酸脑啡肽

（Leu-enkephalin Try-Gly-Gly-phe-Leu）和甲硫氨酸脑啡肽（Met-enkephalin Try-Gly-Gly-Phe-Met），二者仅碳端残基不同。它们在体内易被肽酶水解失去活性，不能用于临床。其后一些其它内源性阿片样多肽被发现，例如 内啡肽（

-endorphin）为31肽，以及  $\mu$ -内啡肽的多种生物活性片断， $\mu$ -内啡肽（1-16片段）、 $\delta$ -内啡肽（1-17片段）、 $\kappa$ -内啡肽（1-27片段）。强啡肽（Dynorphine）为17肽，这些内源性阿片样物质统称内啡肽，但由于易与  $\mu$ -内啡肽造成混淆，现在常使用阿片样肽类（Opioid peptides）这一术语。来源：考试大的美女编辑们 七、阿片受体模型 分析吗啡及合成镇痛药的共同药效构象，提出了3点结合的受体模型，按此模型镇痛药分子需要有以下结构部分： $\mu$  具有一个碱性中心，此中心在生理pH下部分解离，带正电荷，与受体表面负离子部分缔和， $\mu$  具有一个平坦的芳环结构，与受体的平坦区通过范德华力相互作用， $\mu$  碱性中心与芳环共平面，而烃基链部分（吗啡结构中C15-C16）凸出于平面前方，正好与受体的凹槽相适应。百考试题 - 全国最大教育类网站(100test.com) 吗啡及吗啡喃类，苯吗喃类合成镇痛药均具有多环刚性结构，其构象均与吗啡相似。哌啶类和芳基丙胺类为柔性结构，哌替啶结

构中芳环和哌啶环间以单键相连，通过单键自由旋转，与吗啡保持相似构象，美沙酮则通过羰基碳原子上带有部分正电荷，与氨基上孤电子相互吸引，与哌替啶构象一致，它们均与吗啡有相同的药效构象（Pharmacophoric conformation）。三点结合的受体模型是在提出多重阿片受体理论及内源性阿片肽类发现之前，不能解释这些发展，也不能区别激动剂和拮抗剂，在此模型基础上已提出了一些新的阿片受体模型。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](#) 相关推荐：2010年西药师药物化学辅导：药物化学镇痛药（4）2010年西药师药物化学辅导：药物化学镇痛药（3）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](http://www.100test.com)