

2011年药物化学辅导：肾上腺素 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/647/2021\\_2022\\_2011\\_E5\\_B9\\_B4\\_E8\\_8D\\_AF\\_c23\\_647496.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/647/2021_2022_2011_E5_B9_B4_E8_8D_AF_c23_647496.htm) Adrenaline 同时具有较强的  $\alpha$  受体和  $\beta$  受体兴奋作用，临床用于过敏性休克、心脏骤停和支气管哮喘的急救！ Adrenaline 同时具有较强的  $\alpha$  受体和  $\beta$  受体兴奋作用，临床用于过敏性休克、心脏骤停和支气管哮喘的急救。 Adrenaline 具有 苯乙胺的结构骨架。事实上，目前临床应用的拟肾上腺素药物绝大多数都具有这样的基本结构，即取代苯基与脂肪族伯胺或仲胺以二碳链相连，碳链增长或缩短均使作用降低。

- 碳上通常带有醇羟基，此醇羟基再激动剂与受体相互结合时，通过形成氢键发挥作用。因此
- 碳的绝对构型，即 - OH 立体结构排列对活性有显著影响。天然肾上腺素受体激动剂的 - 碳均为 R 构型，合成药物也均以 R 构型为活性体。R 构型 Adrenaline 为左旋体，其活性比右旋体强 12 倍，消旋体的活性只有左旋体的一半。左旋 Adrenaline 水溶液加热或室温放置后，可发生消旋化而致活性降低。消旋化速度与 pH 有关，在 pH 4 以下速度较快，所以 Adrenaline 水溶液应注意控制 pH。

盐酸麻黄素 Ephedrine Hydrochloride Ephedrine 属于混合作用型药物，对  $\alpha$  和  $\beta$  受体均有激动作用，呈现出松弛支气管平滑肌，收缩血管，兴奋心脏等作用。另外，Ephedrine 的极性较儿茶酚胺类为小，因此较易通过血脑屏障进入中枢神经系统，故还具有中枢兴奋作用。与肾上腺素类药物相比，Ephedrine 具有 2 个特点。一是苯环上不带有酚羟基。苯环上酚羟基的存在一般使作用增强。尤其以 3', 4' - 二羟基化合物的活性最强。但具有此

儿茶酚结构的化合物极易受儿茶酚氧位甲基转移酶（COMT）的代谢而口服活性较低，而Ephedrine没有酚羟基，不受COMT的影响，虽作用强度较Adrenaline为低，但作用时间比后者大大延长。苯环上没有酚羟基还使化合物极性大为降低，所以Ephedrine具有较强的中枢兴奋作用。Ephedrine的第二个结构特点是 - 碳上带有1个甲基，因空间位阻不易被单胺氧化酶代谢脱胺，故也使稳定性增加，作用时间延长。单 - 碳上的烷基亦使活性减低，中枢毒性增大。若甲基换以更大的取代基，则活性更弱，毒性更大。特别推荐：

#0000ff>2011年执业药师考试报名条件 #0000ff>报名时间

#0000ff>2011年执业药师考试大纲 更多信息请访问

：#0000ff>2011执业药师辅导精品班 相关链接：#0000ff>2011年药物化学辅导：盐酸普鲁卡因 #0000ff>2011年药物化学辅导：苯氧乙酸类药物 欢迎进入 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)