

# 苯乙胺类拟肾上腺素药





# 拟肾上腺素药的分类

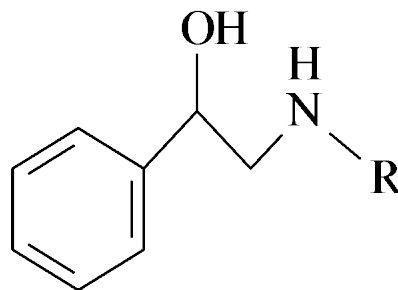


**拟肾上腺素药：**

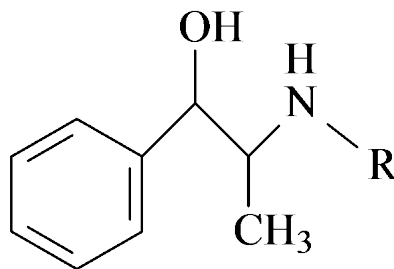
即**肾上腺素能受体激动剂**，是一类能够使肾上腺素能受体激动并产生肾上腺素样作用的药物。

按化学结构分类

苯乙胺类

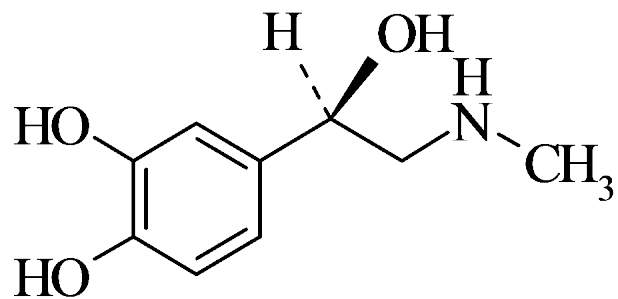


苯异丙胺类





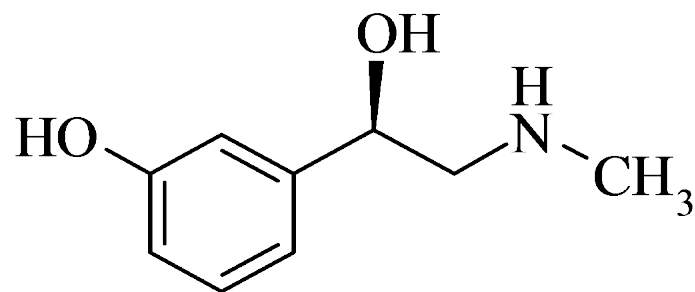
# 苯乙胺类



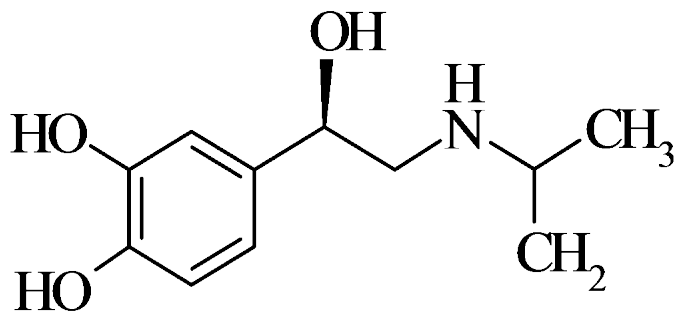
肾上腺素

$\alpha$  受体激动剂，  
升血压，抗休克

$\alpha$ 、 $\beta$  受体激动剂，用于过敏性休克和心脏骤停的急救

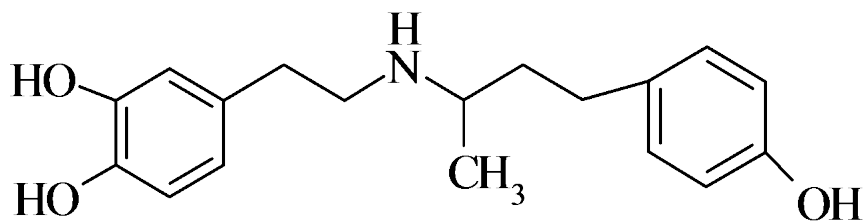


去氧肾上腺素



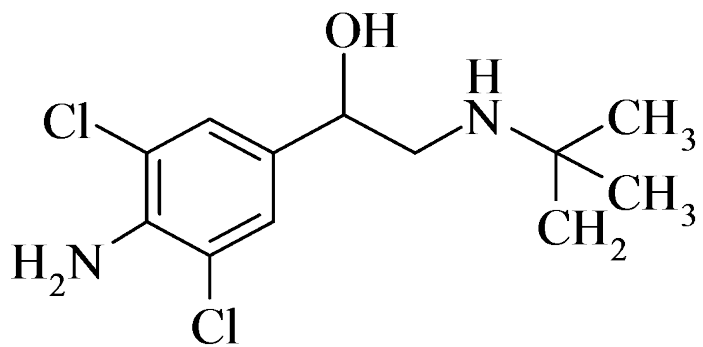
异丙肾上腺素

$\beta$  受体激动剂，临床用于支气管哮喘和抗休克等

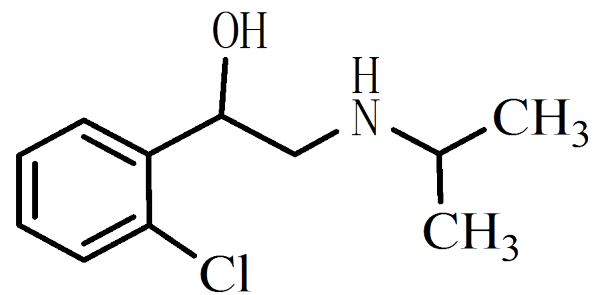


多巴酚丁胺

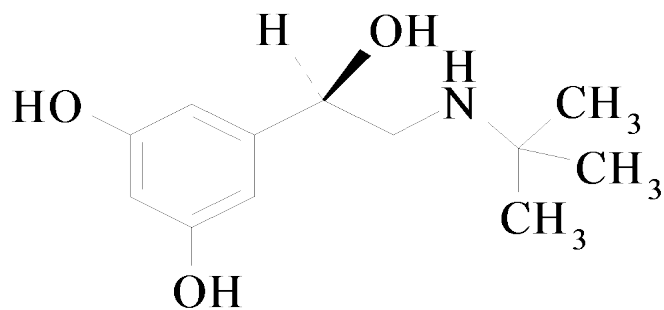
$\beta_1$  受体激动剂，可增强心肌收缩力，几乎不影响血压



克仑特罗



氯丙那林



特布他林

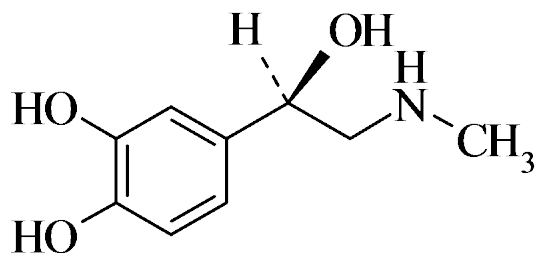
$\beta_2$ 受体激动剂，  
用于支气管哮喘



# 典型药物一：肾上腺素



## 物理性质



肾上腺素

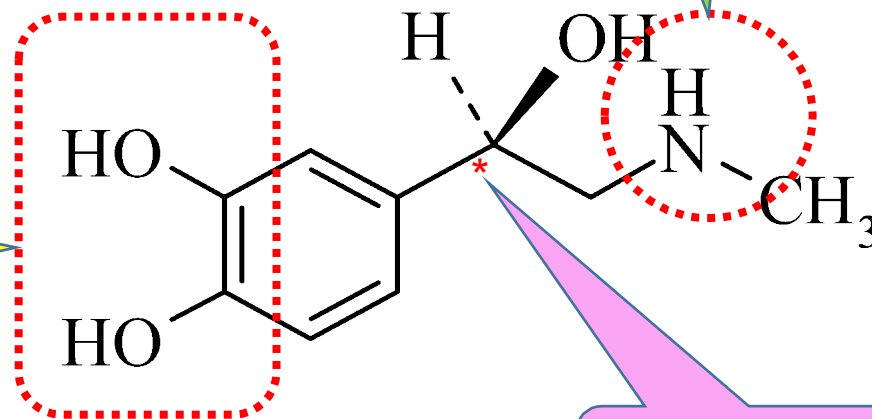


- 白色或类白色结晶性粉末；无臭，味苦。
- 极微溶于水，不溶于乙醇、乙醚、三氯甲烷、酯肪油或挥发油，**易溶于无机酸或氢氧化钠溶液**，不溶于氨溶液或碳酸氢钠溶液。
- 熔点为206~212℃，熔融时同时分解。



## 化学性质

2、邻二酚羟基  
(儿茶酚)



肾上腺素

3、氨基

1、手性碳



# 1. 消旋化反应



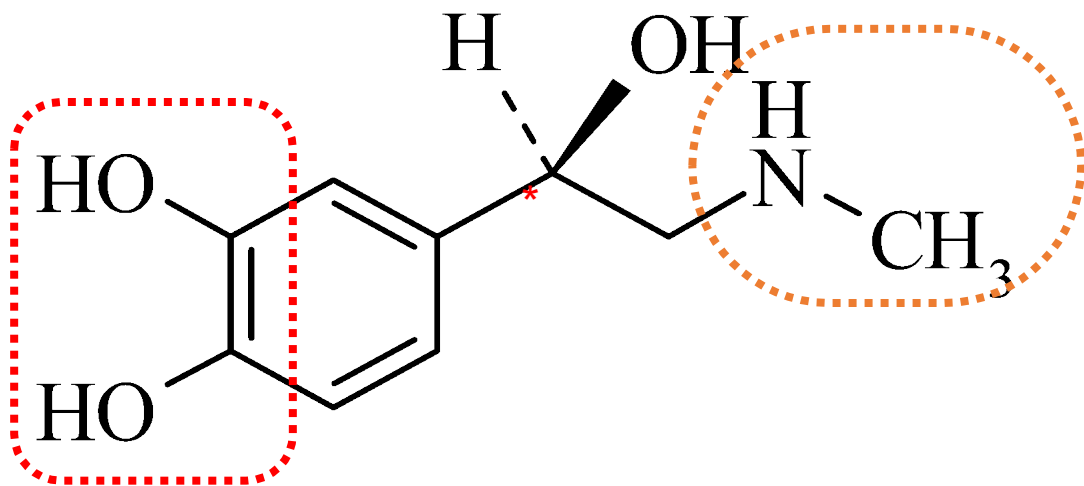
活性减弱





## 2. 酸碱两性

酸性



碱性

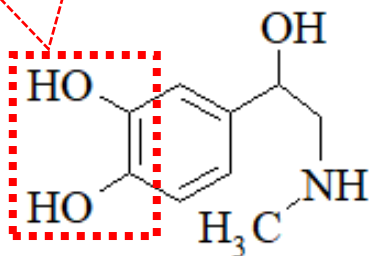
肾上腺素





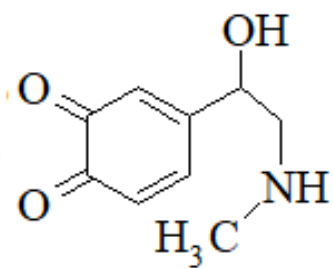
### 3. 还原性

邻苯二酚

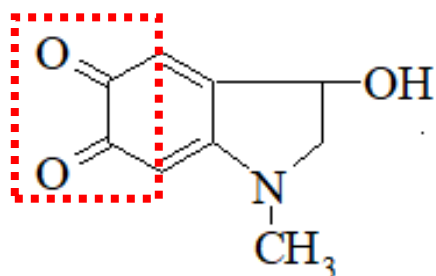


肾上腺素

[O]

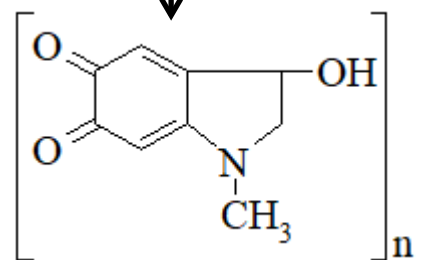


-H<sub>2</sub>



肾上腺素红

聚合



棕色聚合物

提问：如何延缓和防止盐酸肾上腺素注射液氧化变质？



## 影响因素

1、日光

1、药典规定本品注射液pH2.5~5.0，生产单位一般控制pH3.6~4.0；

2、溶液的pH值

2、加入金属离子配合剂乙二胺四醋酸钠，加抗氧化剂焦亚硫酸钠；注射用水经二氧化碳或氮气饱和除去溶解氧，安瓿内同时充入上述气体；

3、微量的金属离子

3、100°C流通蒸汽灭菌15min；

4、温度

4、遮光，减压严封，置阴凉处贮存。



提问：

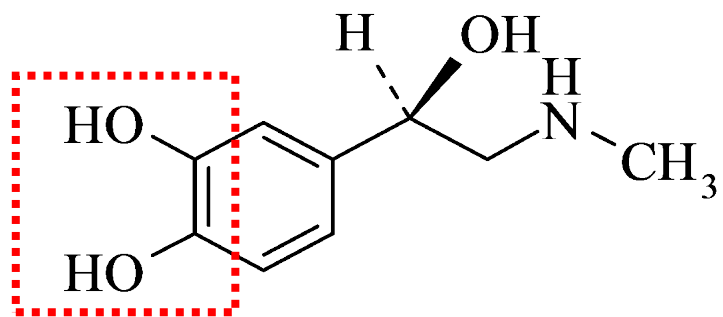
1. 还有哪些药物的化学结构中含有酚羟基？
2. 这些药物在生产、流通、贮存过程中有哪些注意事项？



思维的灵活性

思维的广阔性





肾上腺素

过氧化氢



血红色氧化产物



## 4. 显色反应

- 1、本品溶于稀盐酸后，加过氧化氢试液，煮沸，即显血红色
- 2、与三氯化铁反应：  
本品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

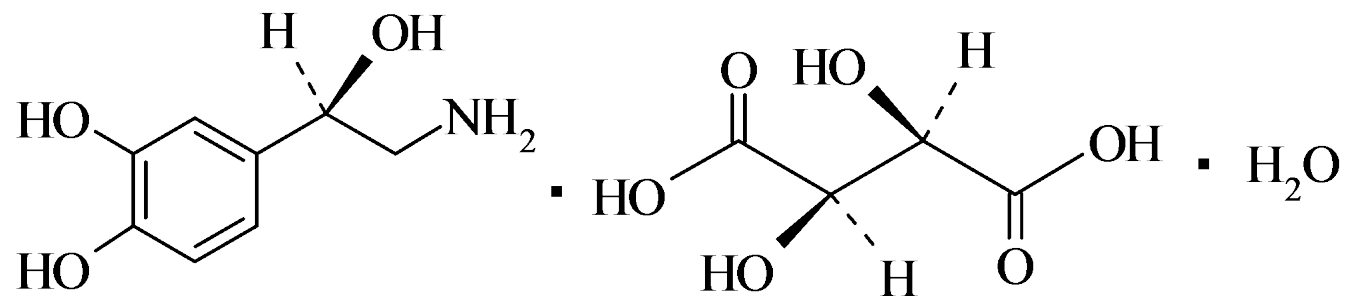


## 临床应用

- 肾上腺素对  $\alpha$  和  $\beta$  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。



## 典型药物二：酒石酸去甲肾上腺素



化学名为 (*R*)-4-(2-氨基-1-羟基乙基)-1,2-苯二酚重酒石酸盐一水合物，又名重酒石酸正肾上腺素。



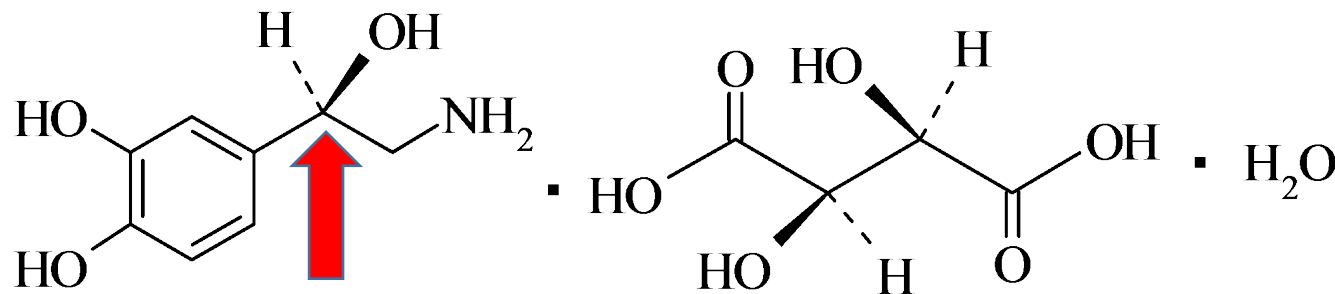


## 物理性质

- 本品为白色或几乎白色的结晶性粉末；
- 无臭，味苦；
- 易溶于水，微溶于乙醇，不溶于三氯甲烷或乙醚；
- 熔点为 $100\sim 106^{\circ}\text{C}$ ，熔融时同时分解。  
比旋度为 $-10^{\circ}\sim -12.0^{\circ}$



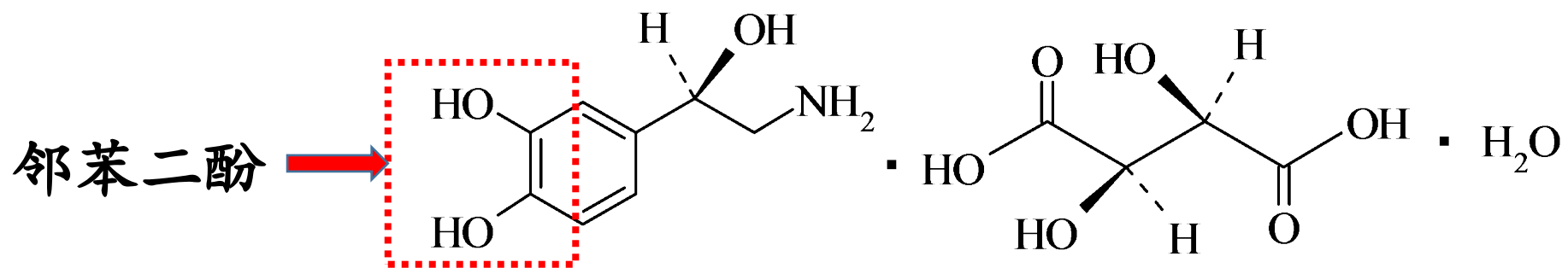
## 化学性质



### 1. 消旋化反应:

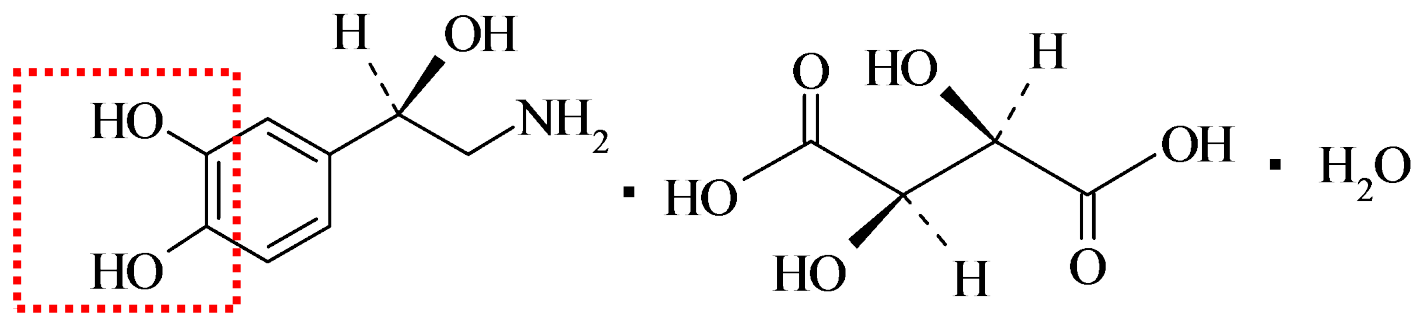
去甲肾上腺素水溶液在室温放置或加热后, 易发生消旋化反应, 使活性降低

**原因:** 药物分子中氨基的 $\beta$ 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。



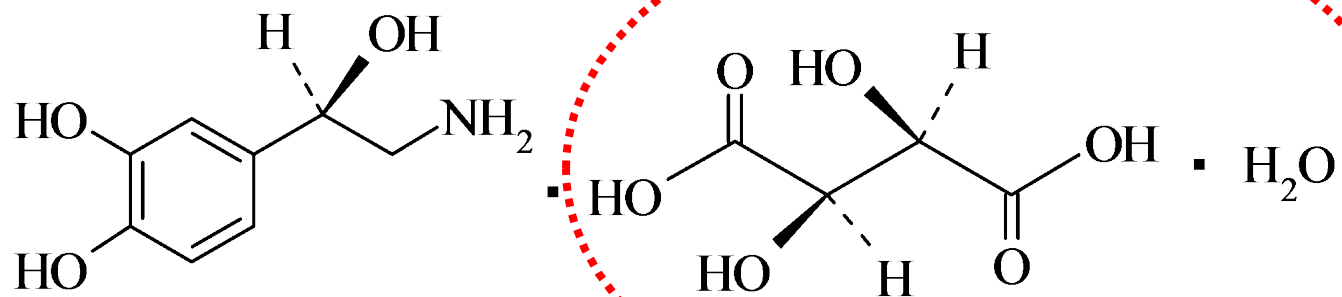
## 2. 还原性

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. 与三氯化铁的显色反应

分子结构中具有酚羟基，与三氯化铁试液反应，即显翠绿色。



4. 药物结构中含有酒石酸，加10%氯化钾溶液析出酒石酸氢钾结晶性沉淀。

以上内容仅为本文档的试下载部分，为可阅读页数的一半内容。如要下载或阅读全文，请访问：  
<https://d.book118.com/378105073107007005>