



浙江药科职业大学
ZHEJIANG PHARMACEUTICAL UNIVERSITY

药物化学 medicinal chemistry

药物代谢反应

浙江药科职业大学 药物化学教研室
周惠燕

2022 MEDICAL DRUG RESEARCH

目录



浙江药科职业大学
ZHEJIANG PHARMACEUTICAL UNIVERSITY

1 概述

2 药物代谢的酶

3 第 I 相生物转化

4 第 II 相生物转化



3

I 相生物转化



3.1 氧化反应

3.1.4 含氮药物的氧化

3.1 氧化反应

3.1.4 含氮药物的氧化

①

N-氧化反应

②

N-脱烷基化反应

③

N-脱胺反应

3.1 氧化反应

3.1.4 含氮药物的氧化

① N-氧化反应



生成N-氧化物：主要是叔胺，含氮芳杂环（如：吡啶环）



生成N-羟化物（羟胺衍生物）：主要是脂肪族及芳香族的伯胺、仲胺、脂肪族酰胺。

3.1 氧化反应

3.1.4 含氮药物的氧化

① N-氧化反应

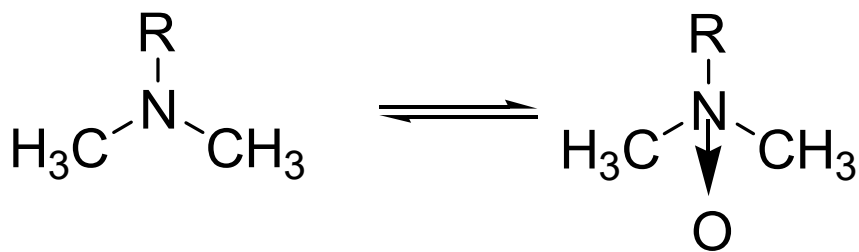
01

生成N-氧化物：主要是叔胺，含氮芳杂环（如：吡啶环）

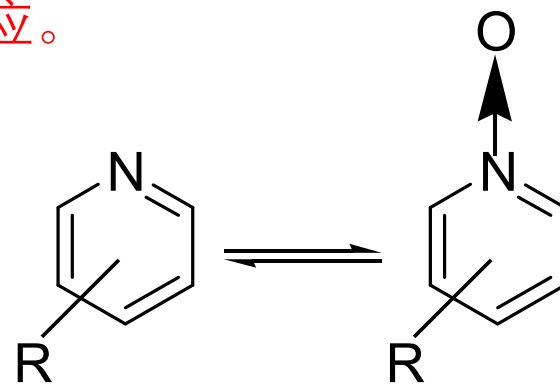
---在体内经氧化代谢为极性更大、亲水性更大的N-氧化物；

---N-氧化反应是可逆的，在细胞色素P450或其它还原酶的作用下，N-氧化物又被还原成其它胺类化合物；

---N-氧化物一般不再进一步发生氧化反应。



叔胺的N-氧化物



吡啶的N氧化物

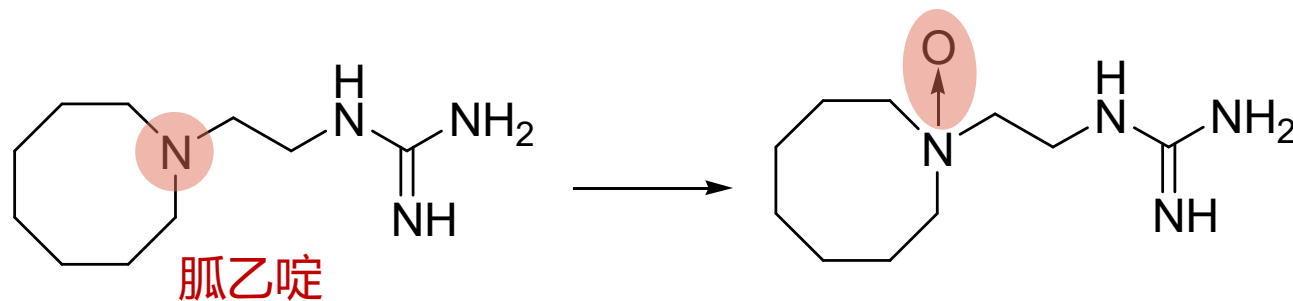
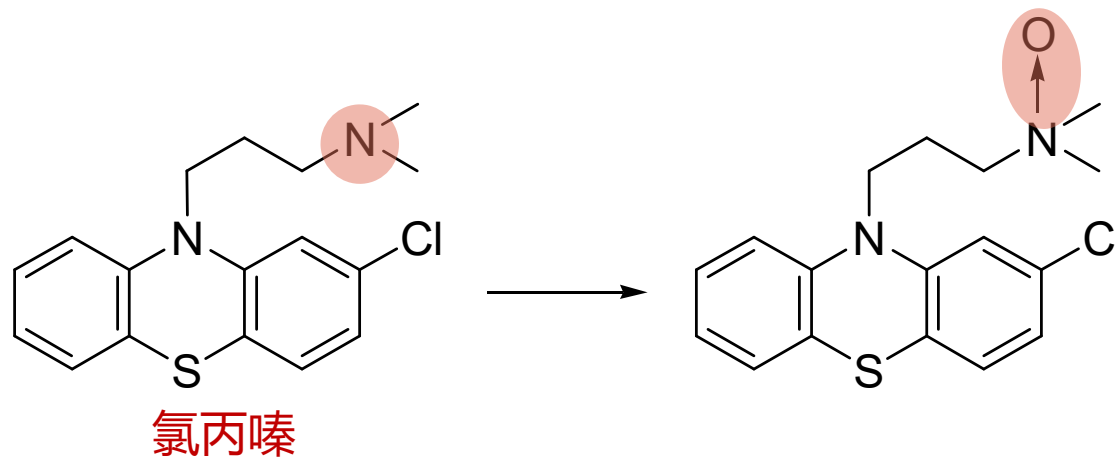
3.1 氧化反应

3.1.4 含氮药物的氧化

① N-氧化反应

01

生成N-氧化物：叔胺最易发生N-氧化反应，可生成稳定的N-氧化物



3.1 氧化反应

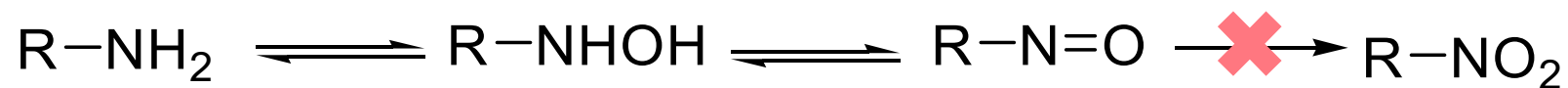
3.1.4 含氮药物的氧化

① N-氧化反应

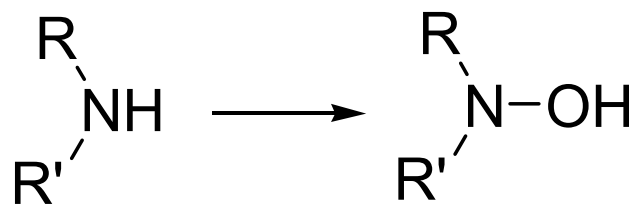
02

生成N-羟化物（羟胺衍生物）：主要是脂肪族和芳香族的伯胺、仲胺、酰胺。

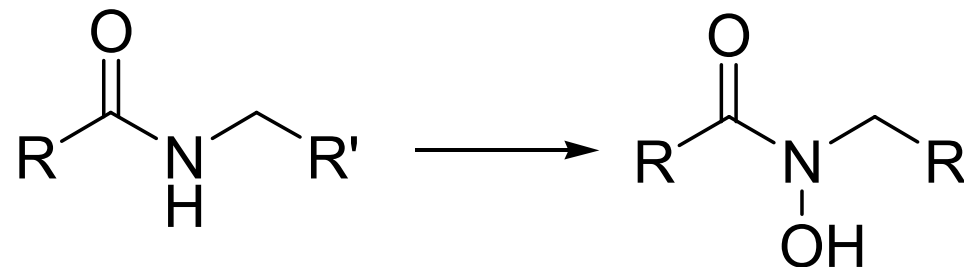
---脂肪族伯胺的N-羟化物还能被氧化为亚硝基化合物，但在体内不能进一步氧化为硝基化合物；



脂肪族伯胺的N-羟化物



仲胺的N-氧化物



酰胺的N-羟化物

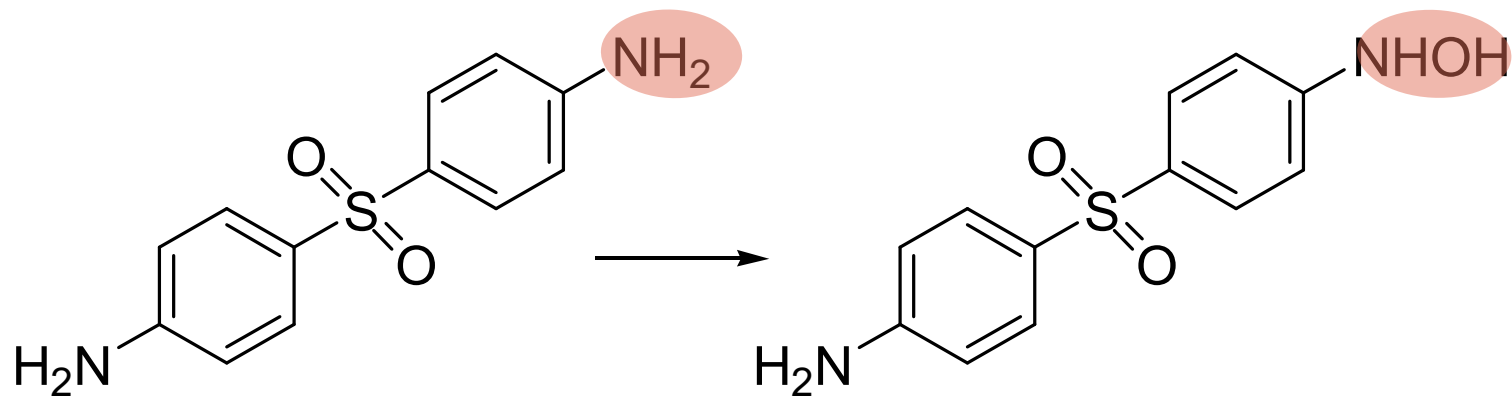
3.1 氧化反应

3.1.4 含氮药物的氧化

① N-氧化反应

02

生成N-羟化物（羟胺衍生物）：主要是脂肪族和芳香族的伯胺、仲胺、酰胺。



氨苯砞

芳香族伯胺的N-羟化物

3.1 氧化反应

3.1.4 含氮药物的氧化

① N-氧化反应

02

生成N-羟化物（羟胺衍生物）：主要是脂肪族和芳香族的伯胺、仲胺、酰胺。

---芳香伯胺、仲胺、酰胺的N-羟化物在体内可产生毒副作用：该类N-羟化物在体内第Ⅱ相生物转化生成乙酸酯或硫酸酯，乙酸酯基和硫酸酯基是比较好的离去基团，易与生物大分子（DNA、RNA）反应生成烷基化的共价结合物，从而产生毒副作用。

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/385330032241011122>