

2011年药物化学辅导：沙丁胺醇 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\\_647495.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/647/2021_2022_2011_E5_B9_B4_E8_8D_AF_c23_647495.htm)

Salbutamol 结构中的叔丁胺基对其作用选择性至关重要。拟肾上腺素药物N上取代基对  $\beta_1$  受体效应的相对强弱有显著影响！Salbutamol 结构中的叔丁胺基对其作用选择性至关重要。拟肾上腺素药物N上取代基对  $\beta_1$  和  $\beta_2$  受体效应的相对强弱有显著影响，见表3 - 6。无取代基如去甲肾上腺素主要为  $\beta_1$  受体效应，对  $\beta_2$  受体作用微弱。当取代基逐渐增大， $\beta_1$  受体效应减弱， $\beta_2$  受体效应则增强。肾上腺素为甲基取代，兼作用于  $\beta_1$  和  $\beta_2$  受体。当取代基增大为异丙基如异丙肾上腺素，主要为  $\beta_2$  受体效应， $\beta_1$  作用极微。Nqdj对受体选择性的这种影响可以解释微在  $\beta_2$  受体结合部位，与氨基相结合的天冬氨酸残基旁边有一个亲脂性口袋，可容纳较大烷基。而  $\beta_1$  受体结合部位没有这样的口袋。取代基的增大有助于和  $\beta_2$  受体的疏水键合，并可使  $\beta_2$  受体变构以便于与拟肾上腺素药的  $\beta$  - 羟基形成氢键。使  $\beta_2$  效应增强最有效的取代基为异丙基、叔丁基和环戊基。不同的取代基可以对不同的  $\beta$  受体亚型产生选择性作用，如N - 叔丁基通常增强对  $\beta_2$  受体的选择性，而N - 异丙基只产生一般受体激动作用。当一般  $\beta$  受体激动剂兴奋  $\beta_2$  受体，作为支气管扩张剂用于平喘时，其同时具有的对  $\beta_1$  受体的兴奋作用会带来一系列的心脏毒性，而选择性  $\beta_2$  受体激动剂则可大大降低和消除这些不良反应。

#### 第四节 组胺H1受体拮抗剂

Histamine H1 Receptor Antagonists 目前临床应用的H1受体拮抗剂品种较多，按化学结构可分为6大类：乙二胺类，氨基醚类

，丙胺类，三环类，哌嗪类，哌啶类等。盐酸曲吡那敏 Tripeleennamine Hydrochloride 为乙二胺类抗组胺药，其H1受体拮抗作用较强而持久，具有一定的抗M胆碱和镇静作用。盐酸苯海拉明 Diphenhydramine Hydrochloride 为氨基醚类抗组胺药。对中枢神经系统有较强的抑制作用。自上世纪40年代应用于临床后，对它的结构改造就没有停止过，并因此获得一系列氨基醚类抗组胺药。如分子中的1个苯基的对位引入甲氧基、氯或溴原子，副作用减轻。马来酸氯苯那敏 Chlorphenamine Maleate 为丙胺类抗组胺药，服用后吸收迅速而完全，排泄缓慢，作用持久，主要是以N - 去一甲基、N - 去二甲基、N - 氧化物等代谢物随尿排出。Chlorphenamine 的特点是抗组织胺作用较强，用量少，副作用小，适用于小儿。丙胺类结构变化的成功之一是其不饱和类似物，如吡咯他敏、曲普利啶和阿伐斯汀。特别是阿伐斯汀具有选择性的阻断组胺H1受体的作用，结构中的丙烯酸基使其具有相当的亲水性而难以进入中枢神经系统，故无镇静作用，也无抗M胆碱作用。特别推荐：[2011年执业药师考试报名时](#)  
[间](#) [报名条件](#) [2011年执业药师考试大纲](#) 更多信息请访问：[2011执业药师辅导精品班](#) 相关链接：  
[2011年药物化学辅导：质子泵抑制剂](#) [2011年](#)  
[药物化学辅导：盐酸普鲁卡因](#) 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)