



# 安徽中醫藥高等專科學校

# 2019



## 安徽省《药物化学》省级精品线下开放课程

Anhui College of Traditional Chinese Medicine | Depart of Pharmacy

安徽中医药高等专科学校 | 药学系

药物化学与药物分析教研室 | 秦亚东



## 第十二章 药物的化学稳定性和药物的代谢反应

---

### 三、药物的代谢反应（下）



# 一、药物的代谢反应

## (二) II相代谢—结合反应

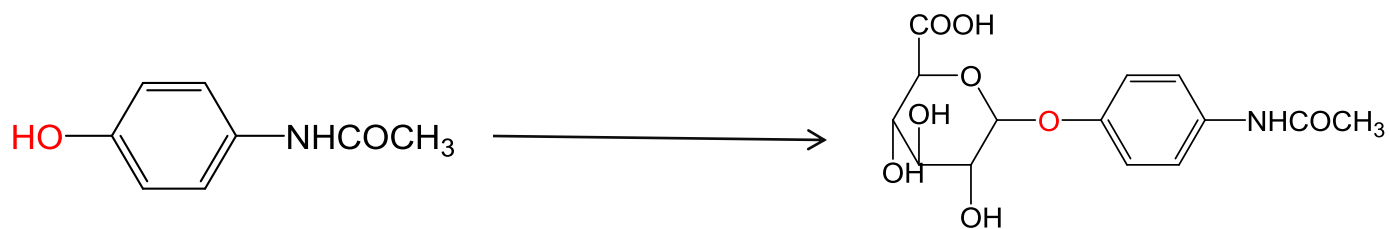
- 有些药物经过 I 相代谢的氧化、还原、水解等转化后，进入 II 相代谢
- 有些药物也可以直接进入 II 相代谢
- 结合反应：I 相代谢产物与内源性成分葡萄糖醛酸、硫酸盐、氨基酸或谷胱甘肽等结合，生产极性大、水溶性高的无药理作用的产物从尿液或胆汁酸排出体外



# 一、药物的代谢反应

## (二) II相代谢—结合反应

### -- 与葡萄糖醛酸结合



对乙酰氨基酚

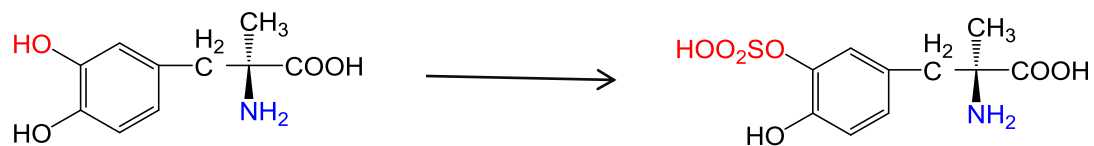
醚型O-葡萄糖苷酸



# 一、药物的代谢反应

## (二) II相代谢—结合反应

### -- 与硫酸基结合



甲基多巴

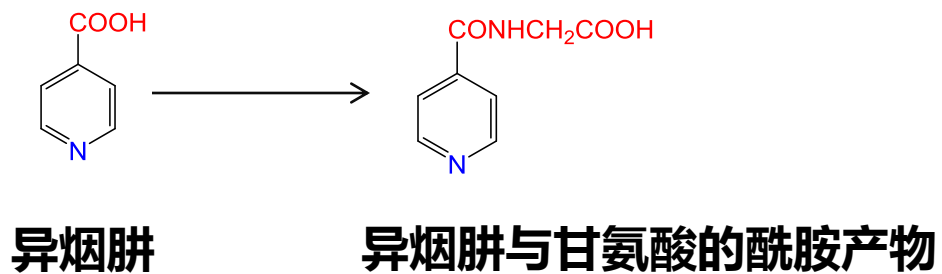
甲基多巴硫酸酯



# 一、药物的代谢反应

## (二) II相代谢—结合反应

### -- 与氨基酸的结合

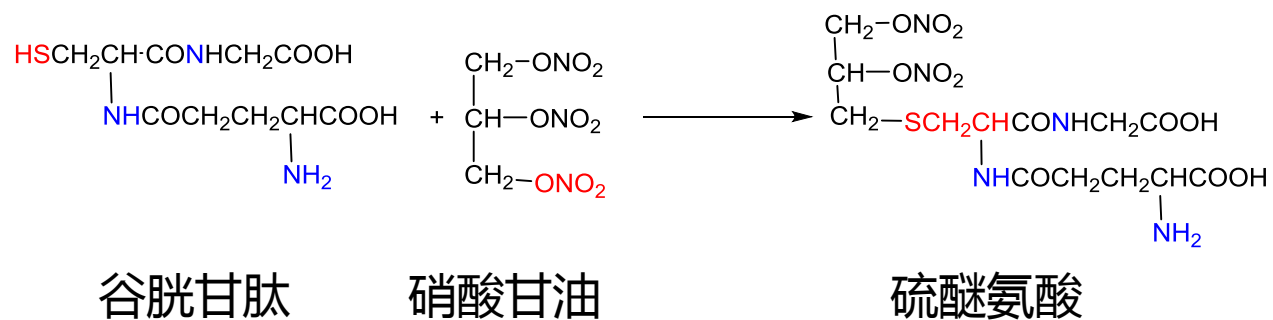




# 一、药物的代谢反应

## (二) II相代谢—结合反应

### -- 与谷胱甘肽的结合

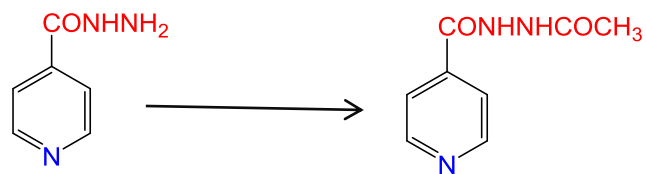




# 一、药物的代谢反应

## (二) II相代谢—结合反应

### -- 乙酰化反应



异烟肼

乙酰异烟肼

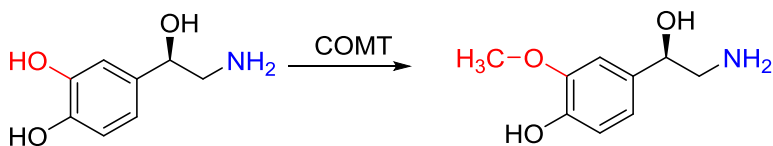


# 一、药物的代谢反应

## (二) II相代谢—结合反应

### -- 甲基化反应

能发生甲基化反应的药物有儿茶酚胺类、苯酚类及胺类等次要结合途径



儿茶酚胺



## 二、药物代谢反应对药物活性的影响

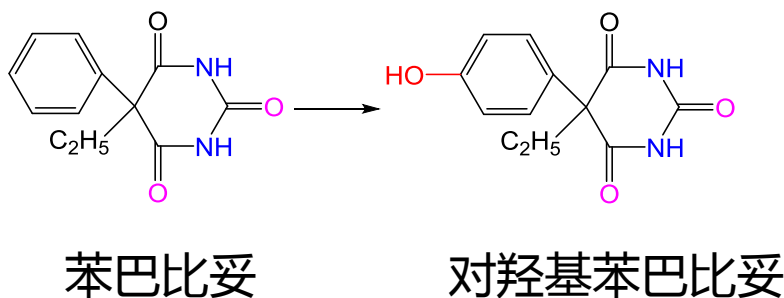
药物经代谢后，其理化性质和生物活性会发生很多改变，主要有以下情况：

- 由活性药物转化为无活性代谢物
- 由无活性药物转化为活性代谢物
- 由活性药物转化为仍有活性代谢物
- 有无毒性或毒性小的药物转化为毒性代谢物
- 经生物转化改变药物的药理作用

## 二、药物代谢反应对药物活性的影响

药物经代谢后，其理化性质和生物活性会发生很多改变，主要有以下情况：

### -- 由活性药物转化为无活性代谢物

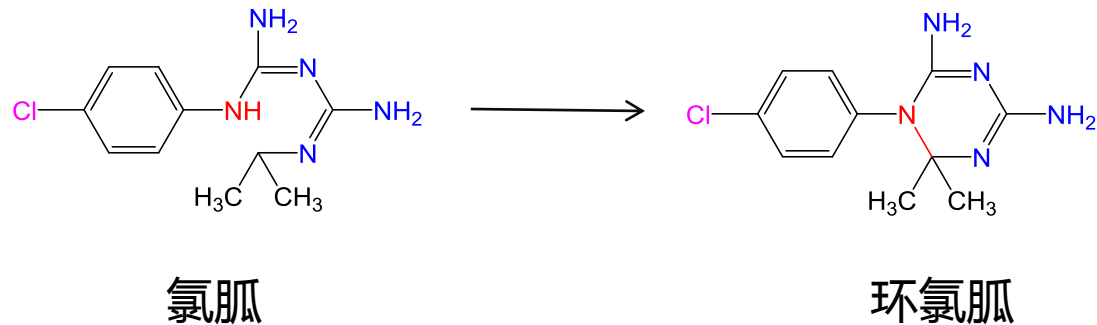


如**苯巴比妥**经生物氧化后成**无催眠镇静作用的对羟基苯巴比妥**而排出体外

## 二、药物代谢反应对药物活性的影响

药物经代谢后，其理化性质和生物活性会发生很多改变，主要有以下情况：

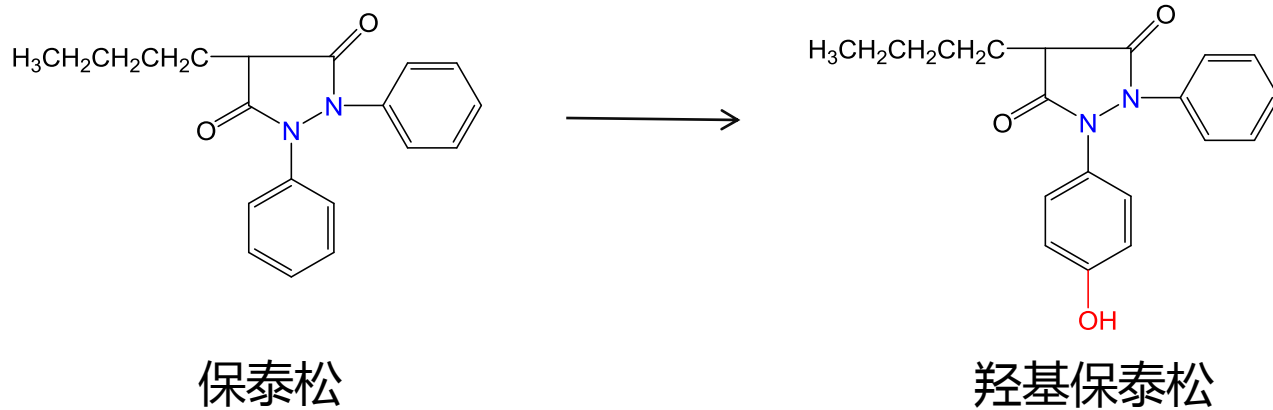
### -- 由无活性药物转化为活性代谢物



如**无生物活性**的**氯胍**经体内氧化后环合成**环氯胍**，具有**抗疟**作用

## 二、药物代谢反应对药物活性的影响

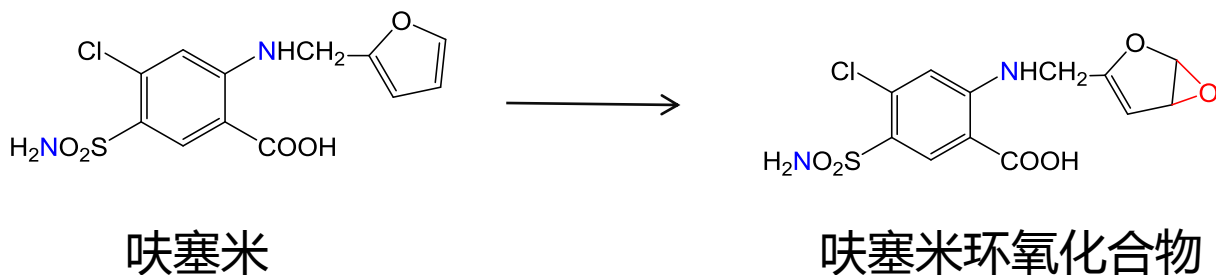
### -- 由活性药物转化为仍有活性代谢物



如**保泰松**在体内代谢成**羟基保泰松**，羟基保泰松的药理作用不如保泰松强，但毒副作用比保泰松小。

## 二、药物代谢反应对药物活性的影响

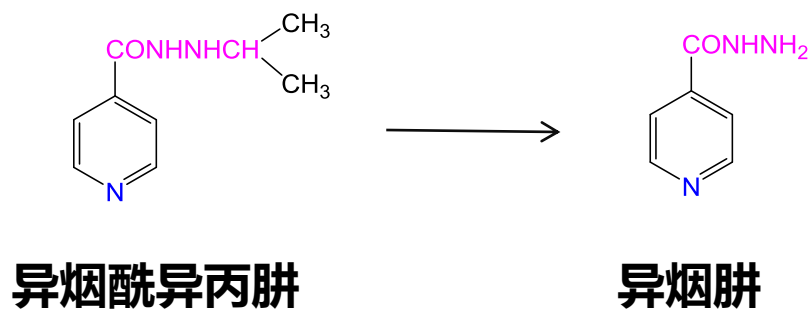
### -- 有无毒性或毒性小的药物转化为毒性代谢物



如利尿药**呋塞米**在机体内氧化后，在原结构的呋喃环上形成毒性**环氧化合物**

## 二、药物代谢反应对药物活性的影响

### -- 经生物转化改变药物的药理作用



如抗忧郁药**异烟酰异丙肼**，经体内作用脱去异丙基成为**异烟肼**，属抗结核杆菌药。



2019

# 安徽省《药物化学》精品线下开放课程

安徽中医药高等专科学校 | 药学系

Anhui College of Traditional Chinese Medicine | Depart of Pharmacy

药物化学与药物分析教研室 | 秦亚东