



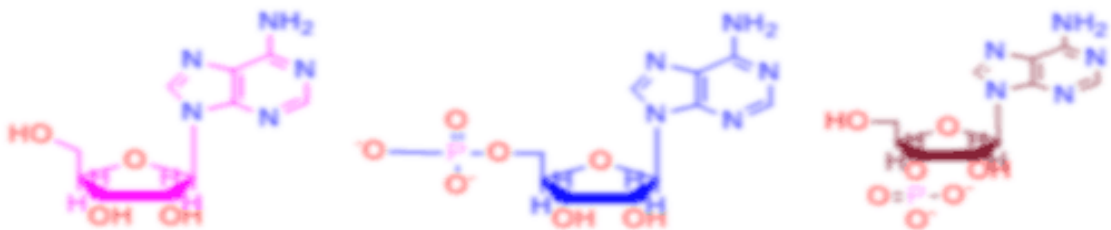
安徽中醫藥高等專科學校

# 2019 安徽省《藥物化學》精品線下開放課程

安徽中醫藥高等專科學校 | 藥學系

Anhui College of Traditional Chinese Medicine | Depart of Pharmacy

藥物化學與藥物分析教研室 | 班超





# 第七章 消化系统药物

## 第二节 胃动力药和止吐药

### 一、胃动力药

(一) 定义：又称促动力药。是指促进胃肠蠕动，加速胃肠排空和转运，协调胃肠运动规律，用于治疗胃肠道动力障碍性疾病的药物。

消化不良



### (二) 分类

#### 1、按照作用部位分类：

- (1) 增强上部胃动力的药物：如甲氧氯普胺、多潘立酮等
- (2) 全胃肠道促动力的药物：如西沙必利等

#### 2、按照作用机制分类：

- (1) 多巴胺D<sub>2</sub>受体拮抗剂 甲氧氯普胺、多潘立酮
- (2) 5-HT<sub>4</sub>受体激动剂 西沙必利

#### 3、按照化学结构分类：

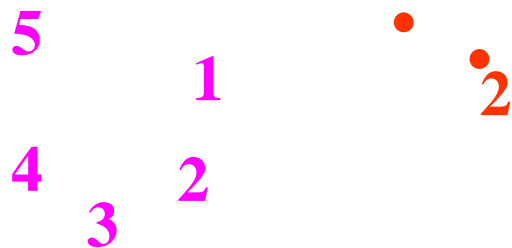
- (1) 苯并咪唑类 多潘立酮（同前）
- (2) 苯甲酰胺类 西沙必利,（甲氧）



# 一、促动力药

## 一、甲氧氯普胺(Metoclopramide)

——苯甲酰胺类化合物



N-[(2-二乙氨基)乙基]-4-氨基-2-甲氧基-5-氯-苯甲酰胺

### 1、性质

- (1) 与硫酸共热，显紫黑色，加水，有绿色荧光，碱化后消失



- (2) 含有叔胺和芳伯胺结构，具有碱性
- (3) 含有芳伯氨基，可发生重氮化反应

## 2、作用机制

为多巴胺D<sub>2</sub>受体拮抗剂

## 3、临床用途

具有促动力作用和止吐作用，是第一个用于临床的促动力药,临床上可治疗消化不良以及肿瘤治疗过程中引起的呕吐。本品有中枢神经系统的副作用（锥体外系症状）



## 二、多潘立酮(Domperidone)



苯并咪唑

——多巴胺D<sub>2</sub>受体拮抗剂

本品极性较大，不能透过血脑屏障，较少甲氧氯普胺的中枢神经系统的副作用。

本品主要用于止吐和促进胃动力作用



■ 下列描述与多潘立酮相符的是( )

- A. 含有苯并咪唑酮结构
- B. 含有芳伯胺基
- C. 含有哌啶环
- D. 易溶于水
- E. 极性大, 不易透过血脑屏障



■ 下列药物中，含有苯并咪唑环的是（ ）

A. 格拉司琼

B. 奥美拉唑

C. 西沙必利

D. 兰索拉唑

E. 多潘立酮



### 三、西沙必利(Cisapride)



——苯甲酰胺的衍生物

分子中有两个手性碳，四个异构体，但药用其顺式的两个外消旋体



## 1、作用机制

选择性地激动5-HT<sub>4</sub>,刺激肠肌间神经丛的乙酰胆碱释放,通过胆碱能神经系统起作用,促进食管、胃、肠道的运动。选择性高。

## 2、体内代谢

有首过效应,主要代谢途径为氮上的去烷基化反应和芳环上的羟基化反应,本品经细胞色素P450进行氧化代谢。

## 3、用途

广泛用于各种以胃肠动力障碍为特征的疾病



## 5、类似药物



莫沙必利(Mosapride)



依托必利(Itopride)



## 二、止吐药

### 1、止吐药的作用机制

A. 作用于延脑的**呕吐中枢**和催吐化学感受区

B. **呕吐神经反射弧**受多种神经递质影响（**5-羟色胺受体**的亚型**5-HT<sub>3</sub>**），止吐药物能**阻断该反射弧**

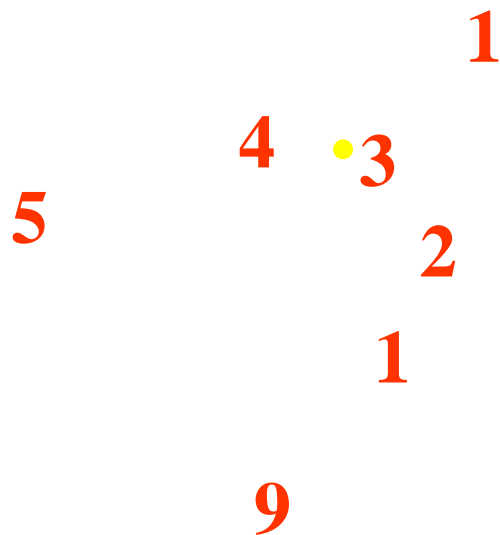


## 2、分类

- 1.多巴胺受体阻断药-----甲氧氯普胺.多潘立酮
- 2.5-HT<sub>3</sub>受体阻断药-----昂丹司琼
- 3.H1受体阻断药 ----- { 苯海拉明
- 4.M受体阻断药----- { 东莨菪碱



# 昂丹司琼(Ondansetron)



咪唑环的3位具有手性，  
R体的活性较大，  
但药用其外消旋体

1,2,3,9-四氢-9-甲基-3-[(2-甲基-1H-咪唑-1-基)甲基]-  
4H-咪唑-4-酮



## (二) 临床用途

本品为**强效、高选择性的5-HT<sub>3</sub>拮抗剂**。对5-HT<sub>1</sub>、5-HT<sub>2</sub>、肾上腺素 $\alpha_1$ 、 $\alpha_2$ 、 $\beta_1$ 、胆碱、GABA、组胺H<sub>1</sub>、H<sub>2</sub>、神经激肽等受体都无拮抗作用。

本品可用于治疗**癌症病人的恶心呕吐症状**，辅助癌症病人的药物治疗，还可用于**预防和治疗手术后的恶心和呕吐**



# 先导物的结构类型

## 1、含咪唑环的结构

INN后缀



为**司琼**

格拉司琼、托烷司琼、  
昂丹司琼

5-羟色胺

## 2、苯甲酰胺类化合物

INN后缀



为**必利**

莫沙必利、依托必利、  
西沙必利

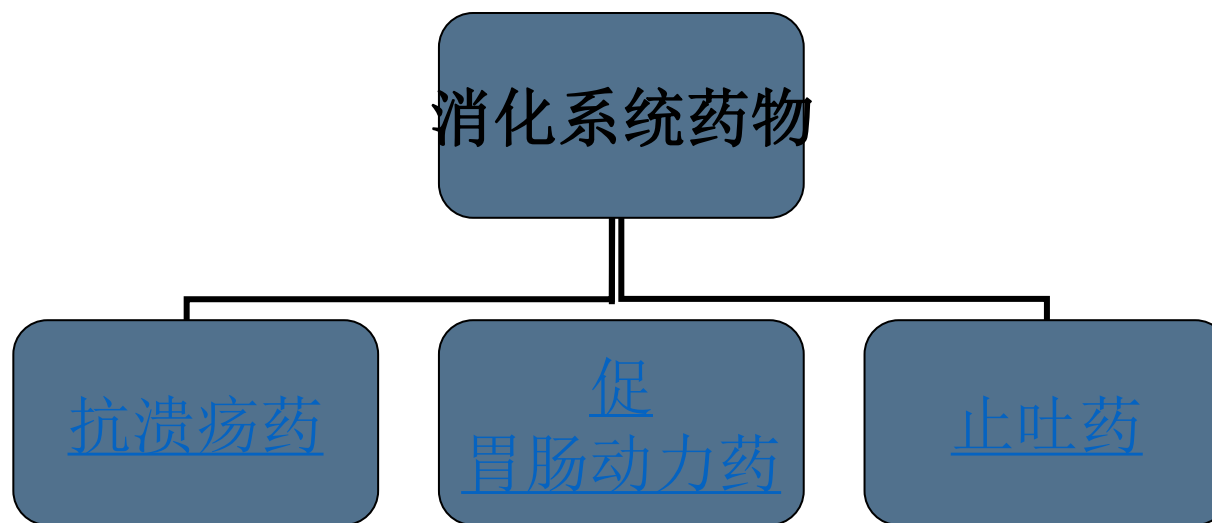
甲氧氯普胺



- 下列药物中，含有咪唑酮结构的是（ ）
- A . 阿托品
  - B . 托烷司琼
  - C . 格拉司琼
  - D . 昂丹司琼**
  - E . 甲氧氯普胺



# 学习小结





# 自测练习

- 可用于胃溃疡治疗的含咪唑环的药物是 ( )
  - A. 盐酸氯丙嗪
  - B. 奋乃静
  - C. 西咪替丁
  - D. 盐酸丙咪嗪
  - E. 多潘立酮



- 下列药物当中，不含带S的四原子链的H<sub>2</sub>受体拮抗剂是（）
  - A.尼扎替丁
  - B.罗沙替丁
  - C.西咪替丁
  - D.甲咪硫脲
  - E.雷尼替丁



■ 下列药物中具有光学活性的是 ( )

A. 雷尼替丁

B. 多潘立酮

C. 西咪替丁

D. 奥美拉唑

E. 甲氧氯普胺

亚砷类，两个基团  
( $R_2$ 、 $R_3$ ) 不同类，  
就具有光学活性



## (二) B型题 (配伍选择题)

- A. 雷尼替丁      B. 奥美拉唑  
C. 多潘立酮    D. 昂丹司琼      E. 西沙必利
1. 分子结构中含有硝基乙烯的药物
  2. 分子中含有芳伯胺基团的药物
  3. 分子结构中含有亚磺酰基的药物
  4. 分子结构中含有苯并咪唑酮的药物
  5. 分子结构中含有咪唑酮的药物

**aebcd**



- A. 甲氧氯普胺      B. 西沙必利  
C. 多潘立酮      D. 昂丹司琼      E. 莫沙必利
1. 具有同质多晶现象的药物
  2. 分子结构中含有乙氧基的药物
  3. 以盐酸盐供临床使用的药物
  4. 第一个用于临床的胃动力药物
  5. 兼有胃动力和止吐作用，但**中枢副作用小**的药物

**bedac**



- A. 甲氧氯普胺      B. 西沙必利  
C. 多潘立酮      D. 昂丹司琼      E. 莫沙必利
1. 具有同质多晶现象的药物
  2. 分子结构中含有乙氧基的药物
  3. 以盐酸盐供临床使用的药物
  4. 第一个用于临床的胃动力药物
  5. 兼有胃动力和止吐作用，但**中枢副作用小**的药物

**bedac**



- A . 雷尼替丁                      B . 奥美拉唑                      C . 多潘立酮
  - D . 昂丹司琼                      E . 西沙必利
- 
- 1 . 属于多巴胺5-HT<sub>3</sub>受体拮抗剂的药物
  - 2 . 属于质子泵抑制剂的药物
  - 3 . 属于多巴胺D<sub>2</sub>受体拮抗剂的药物
  - 4 . 属于多巴胺5-HT<sub>4</sub>受体激动剂的药物
  - 5 . 属于组胺H受体拮抗剂的药物

dbcea



- A . 雷尼替丁            B . 奥美拉唑
  - C . 两者皆有            D . 两者皆无
- 
- 1 . 属于组胺H受体拮抗剂的药物
  - 2 . 属于质子泵抑制剂的药物
  - 3 . 具有几何异构体的有
  - 4 . 不宜长期服用的药物



- 抗溃疡药雷尼替丁具有下列哪些结构 ( )
- A. 含有咪唑环
- B. 含有呋喃环
- C. 含有噻唑环
- D. 含有硝基
- E. 含有二甲氨基甲基

-----多选



■ 下列具有止吐作用的药物有( )

A. 苯海拉明

B. 甲氧氯普胺

C. 格拉司琼

D. 昂丹司琼

E. 多潘立酮

-----多选



- 止吐药的主要结构类型有 ( )
- A. 取代的苯甲酰胺类
- B. 三环类
- C. 二苯甲醇类
- D. 吲哚类
- E. 吡啶甲基亚砷类

-----多选



■ 下列描述与昂丹司琼相符的是( )

A. 含有手性中心

B. 含有咪唑环

C. 以盐酸盐供药用

D. 具有止吐作用

E. 有较明显的锥体外系反应

-----多选



- 为什么质子泵抑制剂抑制胃酸的作用强，且选择性好？

答：



# 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 | Department of Pharmacy

药物化学与药物分析教研室 | 班超