

药物化学

第四章 镇痛药



同步测试

单项选择题

1. 将吗啡 3 位酚羟基修饰为甲氧基可得到 ()。

A. 可卡因

B. 海洛因

C. 可待因

D. 丁卡因

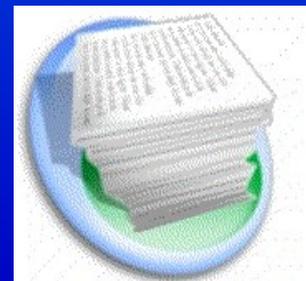
2. 盐酸吗啡注射液久置变色是由于其结构中含有哪种基团 ()。

A. 叔氮原子

B. 醇羟基

C. 酚羟基

D. 咪唑环



3 . 吗啡易被氧化，其氧化产物主要是（ ）。

A . 阿扑吗啡

B . 二氢吗啡酮

C . 双吗啡

D . 双吗啡和 N 氧化吗啡

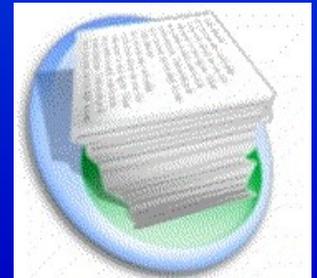
4. 芬太尼作为合成镇痛药所属的结构类型（ ）。

A . 苯基哌啶类

B . 氨基酮类

C . 吗啡烃类

D . 苯吗喃类



5 . 盐酸哌替啶分子中含有的结构特点是 ()。

A 哌嗪环

B 吡啶环

C 哌啶环

D 吡嗪环

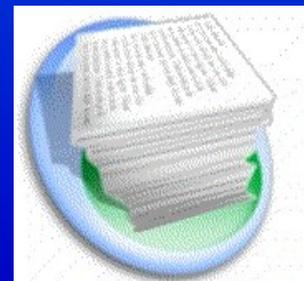
6 . 天然的吗啡是 ()。

A . 左旋体

B . 右旋体

C . 内消旋体

D . 外消旋体

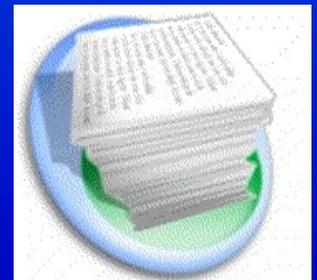


7. 吗啡及合成镇痛药具有相似镇痛活性是因为()。

- A. 具有相似的疏水性
- B. 具有相似的脂水分配系数
- C. 具有不完全相同的构型
- D. 具有共同的药效构象**

8. 既是阿片 μ 受体拮抗剂, 又是 κ 受体激动剂的是()。

- A. 吗啡
- B. 哌替啶
- C. 布托啡诺**
- D. 纳洛酮



多项选择题

1. 属于吗啡的半合成衍生物是 ()。

A. 布托啡诺

B. 纳洛酮

C. 喷他佐辛

D. 可待因

E. 烯丙吗啡

2. 属于苯基哌啶类全合成镇痛药的是 ()。

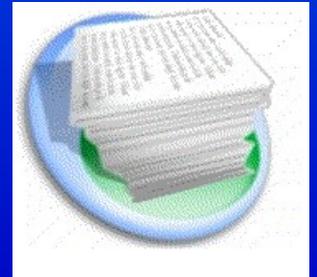
A. 喷他佐辛

B. 哌替啶

C. 芬太尼

D. 美沙酮

E. 吗啡



3. 属于阿片 μ 受体激动剂的是 ()。

A . 吗啡

B . 哌替啶

C . 阿扑吗啡

D . 喷他佐辛

E . 纳洛酮

4. 关于盐酸哌替啶的叙述，正确的是 ()。

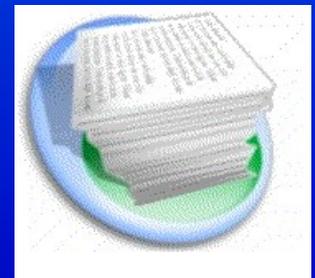
A . 本品与碳酸钠溶液作用，析出游离碱

B . 本品具有酯的特性，室温不易水解

C . 本品的镇痛活性和成瘾性均弱于吗啡

D . 本品口服生物利用度高

E . 本品为阿片 μ 受体激动剂



5 . 下列叙述正确的是 ()。

A . 吗啡 3 位酚羟基甲基化 , 则镇痛活性和成瘾性均下降

B . 吗啡 17 位氮上去甲基 , 镇痛活性下降

C . 吗啡 3、 6 位二羟基均乙酰化 , 则镇痛活性和成瘾性均增加

D . 吗啡 17 位氮上甲基变为其他烷基 , 镇痛活性和成瘾性均下降

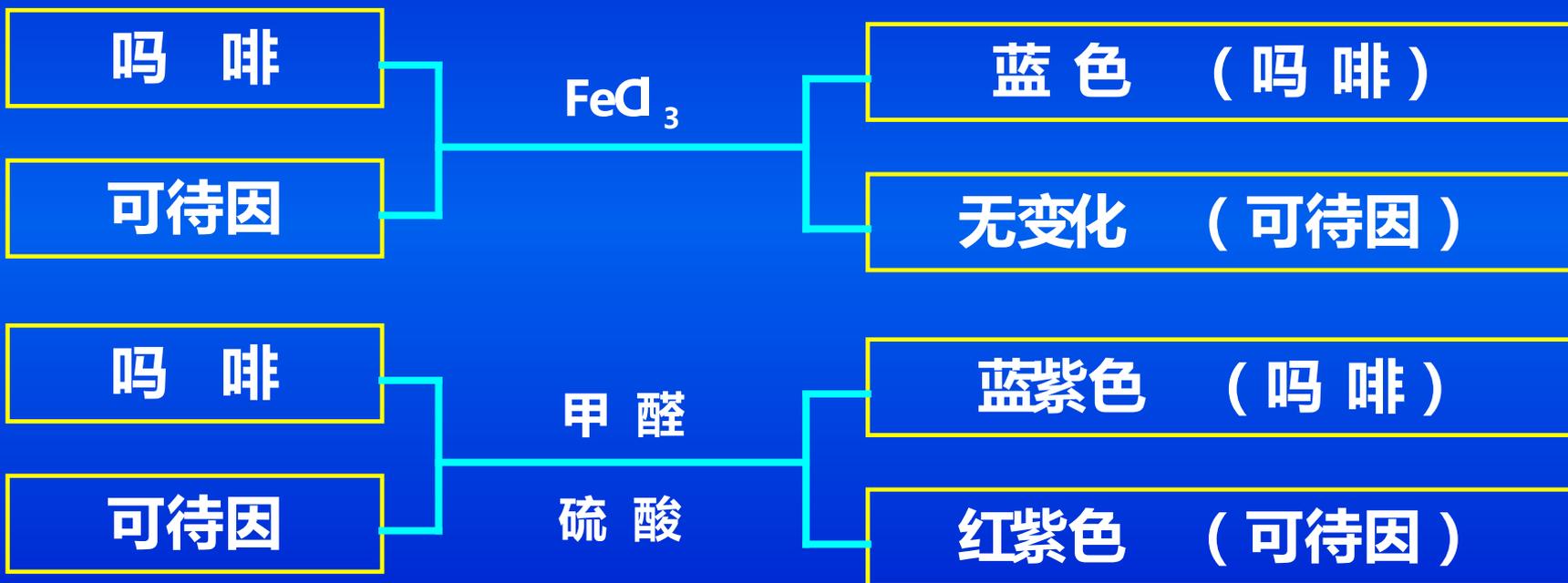
E . 吗啡 3 位酚羟基乙基化 , 则镇痛活性增加 , 成瘾性下降。



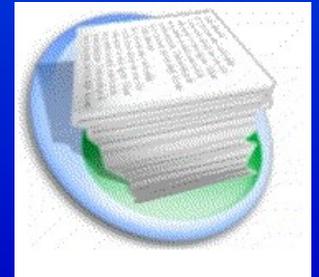
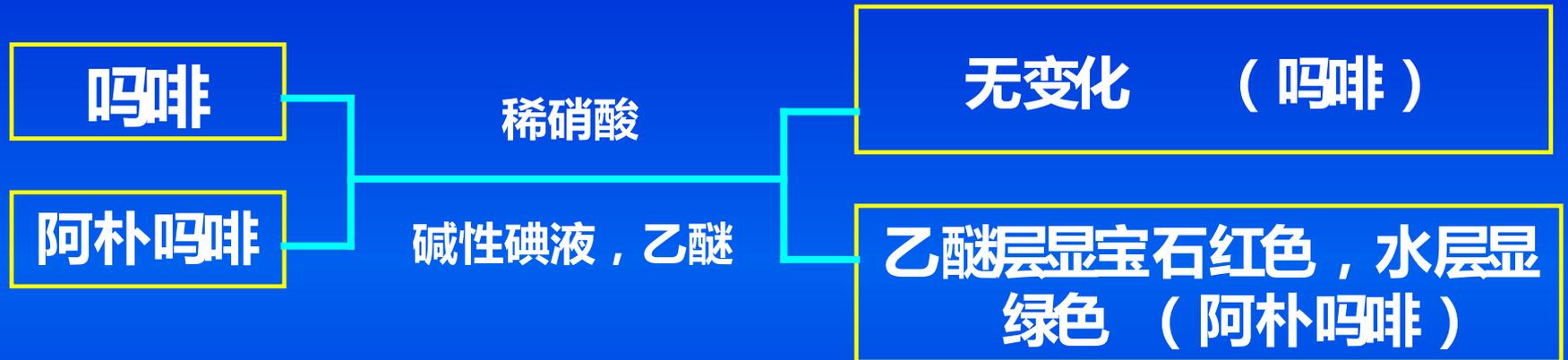
区别题

(用化学方法区别下列各组药物)

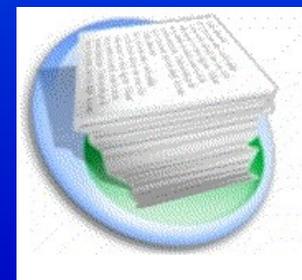
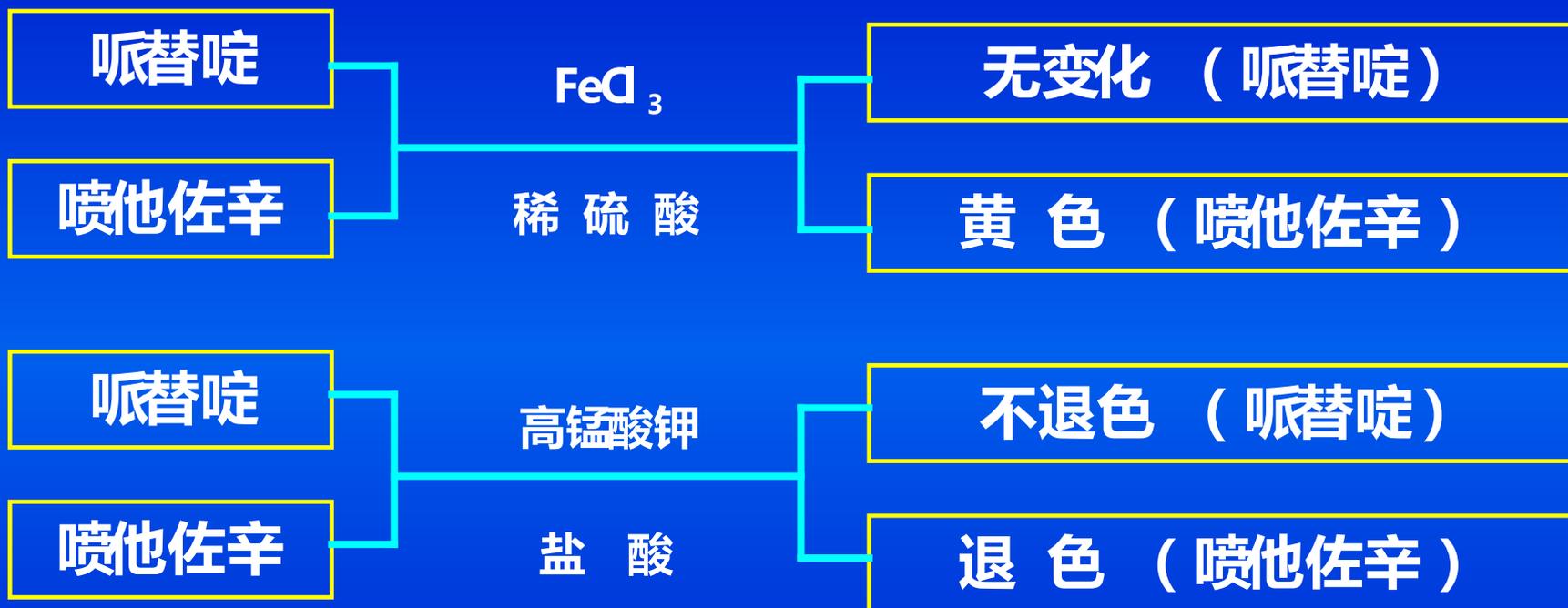
1. 吗啡和可待因



2 . 吗啡和阿扑吗啡



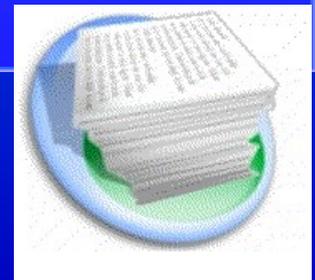
3 . 哌替啶和喷他佐辛



问答题

1. 如何对盐酸吗啡注射液进行合理的配制和保管？为什么？

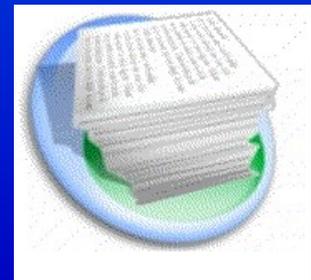
因为盐酸吗啡分子中含有酚羟基，易氧化变色，其注射液在中性或碱性条件下、受日光（紫外线）照射或铁离子等金属离子的因素影响可加速氧化变质。故在配制其注射液时，应调 pH ~ 5，安瓿中充氮气，加入焦亚硫酸钠或亚硫酸氢钠作抗氧化剂和 EDTA-2Na 作稳定剂；控制灭菌温度；贮存时应注意密闭、避光、阴凉处保存。吗啡还因有成瘾性，故须严格按照麻醉药品的保管原则进行保管。



2 . 对吗啡进行哪些方面的结构修饰或结构改造 , 可以得到成瘾性较低的镇痛药 ?

(1) 在结构修饰方面将吗啡 3 位酚羟基烷基化 ; 17 位 N 上去甲基或 17 位 N 甲基变为 N 烯丙基等都可以得到一些成瘾性较低的镇痛药。如可待因、乙基吗啡、羟考酮、烯丙吗啡等。

(2) 另外将吗啡的结构进行适当改变 , 依次打开 E 、 C、 B、 D 环 , 简化其结构 , 可产生吗啡烃类、苯吗喃类、苯基哌啶类、氨基酮类等成瘾性较低的合成镇痛药。如布托啡诺、哌替啶、喷他佐辛、美沙酮等。



3 . 请用“三点论”受体学说阐述镇痛药的构效关系。

“三点论”提出了镇痛药的共同药效模型（构效关系）及阿片受体模型（如图所示），具体概括为以下三点：

（1）分子中具有一个平坦的苯环结构，与受体的平坦区通过范德华力相互作用。

（2）都有一个碱性中心，并能在生理 pH 下部分电离成阳离子，以便与受体表面的阴离子部位相结合。

（3）分子中的苯环以直立键与哌啶环连接，使得碱性中心和苯环几乎处于同一平面上，以便与受体结合；哌啶环的乙撑基突出于平面之前，与受体上一个方向适合的凹槽相适应。

镇痛药与阿片受体作用的三点模式

