

《药专业知识一》易错考点（二）

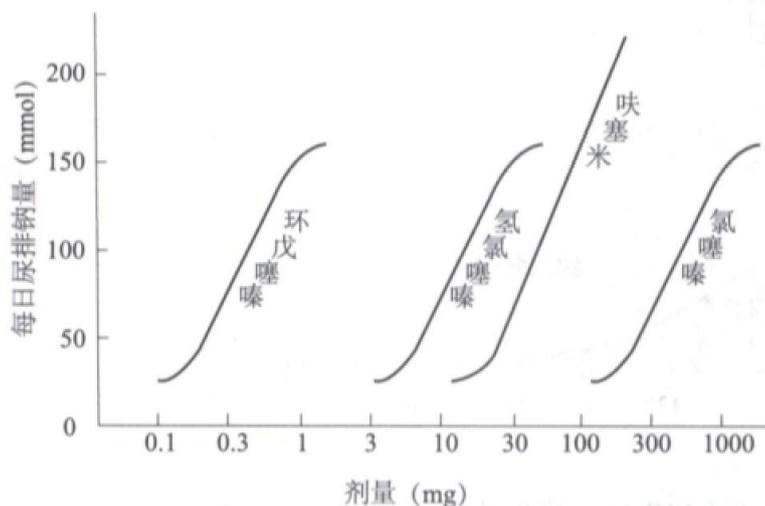
1. 药效学中效能和效价强度容易搞混，如何区分？

效能

在一定范围内，增加药物剂量或浓度，所能达到的最大效应是效能。效能反映了药物的内在活性。效能就是S形曲线的最高点。比效能，就是比S形曲线的个头。

效价强度

引起等效反应（一般采用50%效应量）的相对剂量或浓度，其值越小则强度越大。比效价强度，就是比S形曲线的前后。



从利尿药量-效曲线图中可以看出：

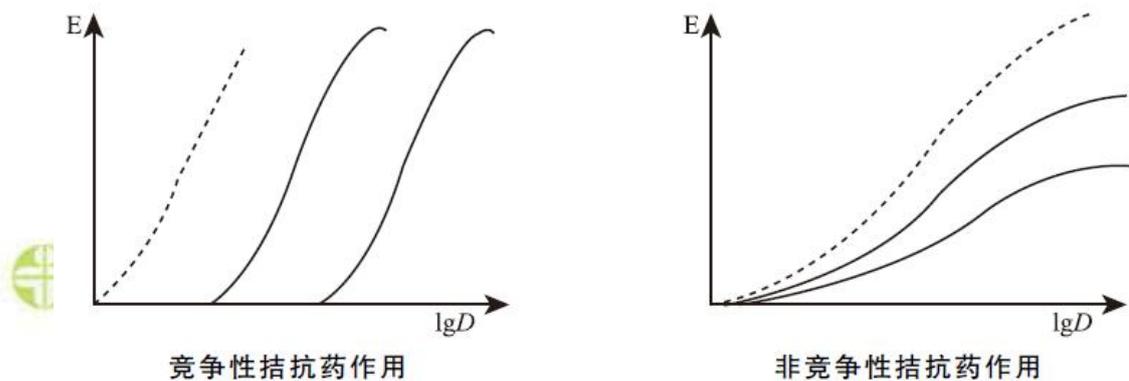
四个药物的效能（S形曲线的最高点）：呋塞米效能最大，其余三个药的效能相同；

四个药物的效价强度（S形曲线的前后）：环戊噻嗪 > 氢氯噻嗪 > 呋塞米 > 氯噻嗪

2. 竞争性拮抗药和非竞争性拮抗药对激动药的影响有何不同？

竞争性拮抗药：竞争性拮抗药可与激动药互相竞争与相同受体结合，产生竞争性抑制作用，可通过增加激动药的浓度使其效应恢复到原先单用激动药时的水平，所以竞争性拮抗药可使激动药的量-效曲线平行右移，最大效应（个头）不变。

非竞争性拮抗药:非竞争性拮抗药与受体形成比较牢固地结合,因而解离速度慢,或者与受体形成不可逆的结合而引起受体构型的改变,阻止激动药与受体正常结合。增加激动药的剂量也不能使量效曲线的最大强度达到原来水平,所以激动剂量-效曲线的效应降低,个头变矮。



图中虚线表示单用时激动药的量-效曲线;实线表示在拮抗药存在时激动药的量-效曲线

3. 解离型和非解离型药物、结合型和游离型药物经常容易搞混,分别是怎么回事儿?

解离型和非解离型针对的是药物本身的状态,有机药物多数为弱酸弱碱,在体液中会部分解离,以解离的形式(离子型)或非解离的形式(分子型)同时存在于体液中。通常药物以非解离的形式(分子型)被吸收,解离的形式(离子型)较难吸收。

由于体内不同部位 pH 不同,影响药物的解离程度,使解离形式和非解离形式药物的比例发生变化,通常酸性药物在 pH 低的胃中、碱性药物在高的小肠中的非解离型药物量增加,吸收也增加,反之都减少。也就是常说的“酸酸碱碱促吸收,酸酸碱碱促排泄”。

结合型和游离型指的是药物吸收入血后与血浆蛋白结合与否。药物被吸收入血后,有一部分与血浆蛋白发生可逆性结合。称结合型,另一部分为游离型。结合型药物有以下特性:①不呈现药理活性;②不能通过血-脑屏障;③不被肝脏代谢灭活;④不被肾排泄。只有游离型药物才能起药物作用。

4. 药专业知识(一)中有些概念相似,不容易区分,总结如下:

①耐受性与耐药性

耐受性的主角是机体，而耐药性的主角是病原微生物等。

耐受性指人体在重复用药条件下形成的一种对药物的反应性逐渐减弱的状态。如麻黄碱静脉注射 3~4 次，升压作用消失，为快速耐受性。口服用药 2~3 天后平喘作用也可消失。

耐（抗）药性：连续反复应用化学治疗药后，病原微生物、寄生虫等对药物的敏感性降低或消失，如耐甲氧西林金葡菌（MRSA）感染，可使用万古霉素治疗。

②后遗效应与停药反应

后遗效应：停药后血药浓度已降低至最低有效浓度以下时仍残存的药理效应。可为短暂或持久。短暂的：苯二氮草类→“宿醉”现象；持久的：长期使用肾上腺皮质激素→肾上腺皮质功能下降

停药反应（反跳反应）：长期服用某些药物，机体对药物产生了适应性，若突然停药或减量过快使机体的调节功能失调而发生功能紊乱，导致病情加重或临床症状上的一系列反跳回升现象。如普萘洛尔、可乐定（突然停药，血压升高）。

③相加作用与增强作用

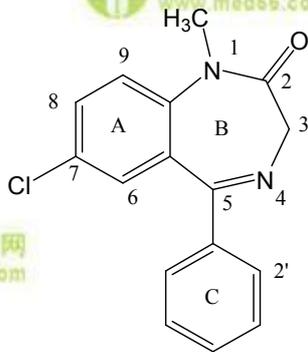
两者均属于协同作用。

相加作用：两药分别作用的代数和（1+1=2）。如阿司匹林+对乙酰氨基酚→解热镇痛作用相加；氨基糖苷类抗生素间合用→毒性增加。

增强作用：两药合用后的作用大于它们分别作用的代数和（1+1>2、1+0>1）。如磺胺甲噁唑与甲氧苄啶合用，使抗菌作用增加数倍至数十倍，甚至出现杀菌作用。

④苯二氮（廿卓）与二苯并氮（廿卓）

苯二氮（廿卓）是苯环并含两个氮原子的七元环的结构，此类药代表药物地



西洋。结构如图

地西洋

二苯并氮(廿卓)是两个苯环并七元环的结构,含有此结构的药物有抗癫痫



药××西平、抗抑郁药丙咪嗪等,结构如图

