

执业西药师考试：《答疑周刊》2021年第23期

问题索引：

1. 【问题】药物的典型官能团对生物活性的影响是怎样的，哪些是增加药物水溶性的？

2. 【问题】关于药物的剂量与效应关系中一些概念及其含义容易混淆怎么区分？

3. 【问题】影响药物制剂稳定性的因素，是怎样分类的？具体有哪些？
具体解答：

1. 【问题】药物的典型官能团对生物活性的影响是怎样的，哪些是增加药物水溶性的？

药物的典型官能团对生物活性的影响

| 官能团 | 对生物活性影响 | 举例 |
|----------------------------|--------------------------|-------------------------|
| 一般能使脂溶性加大，水溶性变差的基团 | | |
| 烃基 | 改变溶解度、解离度、分配系数，位阻↑，稳定性↑ | - |
| 卤素（吸电子，脂溶性） | 影响电荷分布、脂溶性及作用时间[医学教育网原创] | 安定作用：氟奋乃静>奋乃静 |
| 醚和硫醚 | 醚类在脂-水交界处定向分布，易通过生物膜 | 硫醚类可氧化成亚砷或砷，极性↑ |
| 非季铵的胺类 | N上有未共用电子对，显碱性，易与受体形成氢键 | 活性：伯胺>仲胺>叔胺 |
| 磺酸酯、羧酸酯 | 成酯，脂溶性↑，易吸收 | 酯类前药：增加吸收，减少刺激 |
| 一般能使水溶性加大，脂溶性变差的基团 | | |
| 季铵 | 季铵易电离成稳定的铵离子 | 作用强，水溶性大，难透过生物膜，往往无中枢作用 |
| 羟基（脱胎于H ₂ O，水溶性 | 增强与受体结合力，水溶性↑，改变活性 | - |

| | | |
|-------|------------------|-------------------|
| 强) | | |
| 磺酸、羧酸 | 酸可在碱性条件下成盐，水溶性增强 | 磺酸和羧酸成酯：脂溶性增加，易吸收 |

一般常见的可增加药物水溶性的基团有羟基、羧基、磺酸基、季铵基团等。

2. 【问题】关于药物的剂量与效应关系中一些概念及其含义容易混淆怎么区分？

①斜率，表示量效曲线的坡度，斜率大的药物，药量微小的变化，即可引起效应的明显改变。斜率大小在一定程度上可以反映药物的安全性。

②最小有效量，就是引起药理效应的最小药量也称为阈剂量。

③最大效应，是药物所能达到的最大效应，可以反映药物的内在活性，最大效应反映到量效曲线中就是最高点对应的纵坐标。

④效价强度，指的是引起等效反应的相对剂量或浓度，数值越小说明药物的作用强度越大。

⑤半数有效量 (ED_{50})，指的是引起 50%阳性反应 (质反应) 或 50%最大效应 (量反应) 的浓度或剂量。

⑥半数致死量 (LD_{50})，指的是引起 50%试验动物死亡的量，数值越大，药物的毒性越小。

⑦治疗指数 (TI)，计算公式是 LD_{50}/ED_{50} ，[医学教育网原创]它可以表示药物的安全性，数值越大药物越安全。

⑧安全范围，指的是 ED_{95} 和 LD_5 之间的距离，(ED_{95} 是引起 95%阳性反应 (质反应) 或 95%最大效应 (量反应) 的浓度或剂量。 LD_5 指的是引起 5%试验动物死亡的量。) 值越大药物越安全。

3. 【问题】影响药物制剂稳定性的因素，是怎样分类的？具体有哪些？

【解答】影响药物制剂稳定性的因素包括处方因素和外界因素。[医学教育网原创]处方因素包括： pH (H^+ 、 OH^- 催化水解)、广义酸碱催化 (缓冲剂)、溶剂 (苯巴比妥钠+丙二醇)、离子强度 (无机盐)、表面活性剂 (胶束屏障，吐温 80+VD)、基质或赋形剂 (乙酰水杨酸+滑石粉/硬脂酸)；外界因素包括：温度、光线、空气 (氧)、金属离子、湿度和水分 (固体药物-液膜)、包装材料。

独家记忆：酸碱梨吃三剂 (处方因素)

温室光氧金宝财（环境因素）

（注：钱韵文老师原创）

