

医学教育网执业西药师:《答疑周刊》2022年第24期

问题索引:

1. 【问题】药物与受体相互作用学说。
2. 【问题】受体作用的信号转导。
3. 【问题】药物效应的拮抗作用。

具体解答:

1. 【问题】药物与受体相互作用学说。

【解答】受体学说从分子水平阐述机体生理病理过程、药物作用及其机制、药物分子结构与其效应之间的关系[医学教育网原创]。

1. 占领学说: 药物必须占领受体才能发挥作用, 药物效应不仅与被占领的受体数量成正比, 也与药物-受体之间的亲和力和药物的内在活性( $\alpha$ )相关。内在活性大的药物只需要占领少部分受体, 即可产生最大效应, 并不需要占领全部受体。

2. 速率学说: 药物作用主要取决于药物与受体结合及分离的速率, 而与药物占领受体量无关。

3. 二态模型学说: 活化态和失活态两种状态的受体, 可相互转化, 处于动态平衡。激动药与活化态受体亲和力大, 结合产生效应。

2. 【问题】受体作用的信号转导。

【解答】1. 第一信使: 多肽类激素、神经递质、细胞因子及药物等细胞外信使物质。大多数第一信使不能进入细胞内, 而是与靶细胞膜表面的特异受体结合, 激活受体而引起细胞某些生物学特性的改变, 从而调节细胞功能。

2. 第二信使[医学教育网原创]: 最早发现的第二信使是环磷酸腺苷(cAMP), 还有环磷酸鸟苷(cGMP)、二酰基甘油(DAG)、三磷酸肌醇(IP<sub>3</sub>)、前列腺素(PGs)、Ca<sup>2+</sup>、甘碳烯酸类(花生四烯酸)和一氧化氮(NO)等。

3. 第三信使: 负责细胞核内外信息传递的物质, 包括生长因子、转化因子等。

3. 【问题】药物效应的拮抗作用。

【解答】1. 生理性拮抗: [医学教育网原创]两个激动药分别作用于生理作用相反的两个特异性受体。例如: 自体活性物质组胺可作用于H<sub>1</sub>组胺受体, 引

起支气管平滑肌收缩,使小动脉小静脉和毛细血管扩张,毛细血管通透性增加,引起血压下降,甚至休克;肾上腺素作用于 $\beta$ 肾上腺素受体使支气管平滑肌松弛,小动脉、小静脉和毛细血管前括约肌收缩,可迅速缓解休克,用于治疗过敏性休克;组胺和肾上腺素合用则发挥生理性拮抗作用。

2. 生化性拮抗:两药联合用药时一个药物的药效降低。例如,苯巴比妥诱导肝微粒体酶活性,使避孕药代谢加速,效应降低,使避孕失败。

3. 化学性拮抗:两药联合用药时一个药物通过诱导化学反应形成合用药物的无活性复合物而使另外一个药物的药效降低。例如,肝素过量可引起出血,静注鱼精蛋白注射液解救,因后者是带有强大阳电荷的蛋白,能与带有强大阴电荷的肝素形成稳定的复合物,使肝素的抗凝血作用迅速消失。

4. 药理性拮抗:当一种药物与特异性受体结合后,阻止激动药与其结合,从而降低药效。例如:组胺 $H_1$ 受体阻断药苯海拉明可阻断 $H_1$ 受体激动药的作用; $\beta$ 受体阻断药可阻断异丙肾上腺素的 $\beta$ 受体激动作用。上述两药合用时的作用完全消失又称抵消作用,而两药合用时其作用小于单用时的作用则称为相减作用。