

医学教育网主管药师: 《答疑周刊》2023年第25期

问题索引:

1. 【问题】关于受体激动剂、拮抗剂的亲和力、内在活性的相关内容有哪些?
2. 【问题】关于有机磷酸酯类中毒的机制以及解救办法是什么?
3. 【问题】治疗幽门螺杆菌感染所致的溃疡通常采用哪些给药方式?

具体解答:

1. 【问题】关于受体激动剂、拮抗剂的亲和力、内在活性的相关内容有哪些?

【解答】[医学教育网原创]亲和力: 药物与受体结合的能力。不同药物与受体的亲和力不同。

内在活性: 或称效能, 是指药物激动受体产生最大效应的能力。具有内在活性的药物可以产生类似递质激动受体的效应。激动剂的内在活性可能小于或等于1。[医学教育网原创]

激动剂	完全激动剂	有很大的亲和力和内在活性, 能与受体结合并产生最大效应。
	部分激动剂	具有一定的亲和力, 内在活性低, 与受体结合后只能产生较弱的效应。即使浓度增加, 也不能达到完全激动剂那样的最大效应, 与激动剂合用, 可因占据受体而能拮抗激动剂的部分生理效应。
拮抗剂	竞争性拮抗剂	虽具有较强的亲和力, 能与受体结合, 但缺乏内在活性, 结合后非但不能产生效应, 同时由于占据受体而拮抗激动剂的效应, 但可通过增加激动剂浓度使其达到单用激动剂时的水平。竞争性拮抗剂与激动剂竞争相同的受体, 且其拮抗作用可逆, 与激动剂合用时的效应取决于两者的浓度和亲和力。
	非竞争性拮抗剂	非竞争性拮抗剂与激动剂虽不争夺相同的受体, 但它与受体结合后可妨碍激动剂与特异性受体结合; 或非竞争性拮抗剂通过共价键作用与受体结合牢固, 呈不可逆性, 妨碍激动剂与特异性受体结合。不断提高激动剂浓度, 也不能达到单独

	使用激动剂时的最大效应。
--	--------------

2. 【问题】关于有机磷酸酯类中毒的机制以及解救办法是什么？

【解答】【急性中毒机制】有机磷酸酯类进入机体后，其含磷基团中亲电性的磷与胆碱酯酶酯解部位丝氨酸羟基中的亲核性氧进行共价键结合，生成磷酸化胆碱酯酶复合物。该复合物结合牢固而持久，不易水解，胆碱酯酶活性难以恢复，从而导致乙酰胆碱在突触间隙内大量积聚，产生一系列中毒症状。

早期用胆碱酯酶复活药可部分恢复胆碱酯酶的活性，若抢救不当或中毒时间过长，可造成胆碱酯酶“老化”，此时再用胆碱酯酶复活药也难以奏效，必须待新生的胆碱酯酶出现才能水解乙酰胆碱。因此一旦中毒，必须迅速抢救并尽早使用胆碱酯酶复活药。[医学教育网原创]

【急性中毒症状】急性有机磷酸酯类中毒症状表现多样。轻度中毒以M样症状为主，中度中毒表现为M样和N样症状，重度中毒除M和N样症状外，还出现中枢神经系统症状。急性中毒死亡可发生在5分钟至24小时内，取决于摄入体内的毒物种类、剂量、途径及其他因素等。

3. 【问题】治疗幽门螺杆菌感染所致的溃疡通常采用哪些给药方式？

【解答】治疗幽门螺杆菌感染所致的溃疡可采用下列药物合用：

- (1) 兰索拉唑和阿莫西林；[医学教育网原创]
- (2) 阿莫西林、克拉霉素和兰索拉唑（或奥美拉唑）；
- (3) 四环素、甲硝唑和铋盐。

联合用药后明显提高幽门螺杆菌的清除率，抑制溃疡，降低复发率。