

医学教育网执业西药师: 《答疑周刊》2022 年第 25 期

问题索引:

1. 【问题】第八章根据药物与受体作用情况对药物分类需要掌握哪些内容, 如何区分记忆?
2. 【问题】生物药剂学中注射给药途径有多种, 如何区分记忆?
3. 【问题】脂质体的质量要求有哪些?

具体解答:

1. 【问题】第八章根据药物与受体作用情况对药物分类需要掌握哪些内容, 如何区分记忆?

【解答】因为都可以与受体结合, 所以不论是激动剂还是拮抗剂与受体的亲和力都比较强, 主要区分各类药物的内在活性、特点。

(1) 药物与受体相互作用的动力学: 药物和受体结合产生效应不仅要有亲和力, 还要有内在活性, [医学教育网原创]内在活性用  $\alpha$  表示,  $0 \leq \alpha \leq 100\%$ 。完全激动药  $\alpha = 100\%$ , 部分激动药  $\alpha < 100\%$ 。

(2) 药物分类

分类		亲和力	内在活性	特点
激动药	完全激动药 (吗啡)	较强	$\alpha = 1$	-
	部分激动药 (喷他佐辛)	较强	$0 < \alpha < 1$	与激动药并用还可拮抗激动药的部分效应
	反向激动药	较强	$0 < \alpha$	对失活态受体亲和力大于活化态, 引起与激动药相反的效应 (苯二氮草类)
拮抗药	竞争性拮抗药	较强	$\alpha = 0$	$E_{\max}$ 不变、量效曲线平行右移
	非竞争性拮抗药	较强	$\alpha = 0$	$E_{\max}$ 下降

2. 【问题】生物药剂学中注射给药途径有多种, 如何区分记忆?

【解答】对于注射给药需要强调的是静脉注射给药没有吸收过程药物直接进入血, 生物利用度 100%, 另外注意皮下和皮内注射的应用, 可以总结成下表对比记忆:

注射类别	注射部位	注射量	特点
静脉注射	静脉血管	数毫升至数升	无吸收过程,生物利用度 100%
肌肉注射	肌肉内	2~5ml	油溶液或混悬剂可发挥长效作用
皮下注射	表皮与肌肉之间	1~2ml	适用于需延长作用时间的药物[医学教育网原创]
皮内注射	真皮	≤0.2ml	用于诊断和过敏试验
动脉注射	靶组织或器官	-	用于肿瘤治疗

### 3. 【问题】脂质体的质量要求有哪些？

**【解答】**脂质体的粒径大小及其分布、包封率、载药量和稳定性等可直接影响脂质体在体内的分布与代谢, [医学教育网原创]最终影响疗效及毒副作用, 因此需要密切关注并加以严格控制。除应符合《中国药典》有关制剂通则规定外, 还需控制以下项目:

#### (1) 形态、粒径及其分布

脂质体的形态应为封闭的多层囊状物, 根据给药途径不同其粒径要求不同。如注射给药脂质体的粒径应小于 200nm, 且分布均匀, 呈正态性, 跨距宜小。

#### (2) 包封率

包封率:  $[\text{脂质体中的药量} / (\text{介质中的药量} + \text{脂质体中的药量})] \times 100\%$ , 通常要求脂质体的药物包封率达 80%以上。

#### (3) 载药量

载药量 =  $[\text{脂质体中药物量} / (\text{脂质体中药量} + \text{载体总量})] \times 100\%$

载药量的大小直接影响到药物的临床应用剂量, 故载药量愈大, 愈易满足临床需要。

#### (4) 脂质体的稳定性

a. **物理稳定性:** 主要用渗漏率表示, 即在贮存期间脂质体的包封率变化情况。  
渗漏率 =  $(\text{贮存后渗漏到介质中的药量} / \text{贮存前包封的药量}) \times 100\%$

b. **化学稳定性:** ①**磷脂氧化指数:** 氧化指数 =  $A_{233\text{nm}} / A_{215\text{nm}}$ ; 一般规定磷脂氧化指数应小于 0.2。②**磷脂量的测定:** 基于每个磷脂分子中仅含 1 个磷元素, 采用化学法将样品中磷脂转变为无机磷后测定磷摩尔量 (或重量), 即可推算出磷脂

量。③防止氧化的措施：防止氧化的一般措施有充入氮气，添加抗氧化剂。



正保医学教育网  
www.med66.com