

医学教育网主管药师：《答疑周刊》2023年第21期

问题索引：

1. 【问题】完全激动剂、部分激动剂的区别？
2. 【问题】怎么区分一级动力学消除和零级动力学消除？
3. 【问题】钙通道阻滞剂抗心绞痛的作用机制是什么？

具体解答：

1. 【问题】完全激动剂、部分激动剂的区别？

【解答】(1)完全激动剂：也称激动剂，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。[医学教育网原创]

(2)部分激动剂：具有一定的亲和力，但内在活性低，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，可因占据受体而拮抗激动剂的部分生理效应。

2. 【问题】怎么区分一级动力学消除和零级动力学消除？

【解答】[医学教育网原创]

(1)一级动力学消除(恒比消除)：是指单位时间内药物按恒定的比例进行消除。药物的消除速度与血药浓度成正比。机体消除功能正常，体内药量未超过机体最大消除能力时，药物按恒比消除，如绝大多数药物在治疗量时的消除。

(2)零级动力学消除(恒量消除)：是指单位时间内药物按恒定的数量进行消除。药物的消除速度与血药浓度无关。机体消除功能低下或用药剂量过大超过机体最大消除能力时，机体消除能力达饱和，只能以恒定的最大速度恒量消除，当血药浓度下降到最大消除能力以下时，可转化为恒比消除。

3. 【问题】钙通道阻滞剂抗心绞痛的作用机制是什么？

【解答】钙通道阻滞药通过阻断电压依赖性钙通道，降低 $Ca^{2+}$ 内流而产生作用。

(1)降低心肌耗氧量 多数钙通道阻滞药能使心肌收缩性下降，心率减慢，血管平滑肌松弛，减轻心脏负荷，从而降低心肌耗氧量。

(2)舒张冠状血管 本类药物可以舒张冠脉大的输送血管和小的阻力血管，增加侧支循环，从而改善缺血区的供血供氧。

(3)保护缺血心肌细胞 心肌缺血时，细胞内 $Ca^{2+}$ 超负荷，线粒体过多的

$\text{Ca}^{2+}$ 可妨碍 ATP 的产生，导致细胞死亡。钙通道阻滞药因能减少细胞内  $\text{Ca}^{2+}$ ，而对缺血心肌有保护作用。[医学教育网原创]

(4) 抑制血小板聚集 不稳定型心绞痛与血小板黏附和聚集、冠脉血流减少有关。钙拮抗药可以降低血小板内  $\text{Ca}^{2+}$ 浓度，抑制血小板聚集。

