

添加学霸君微信号“ks233wx7”，拉你进 2020 年执业药师药师备考交流群。

通过 233 网校 APP—我的资料包，下载更多执业药师学习资料，最新章节习题，模拟试题，历年真题在线免费做！

[点击领取 >> 执业药师新人大礼包\(购课优惠券+精讲班免费视频+精华资料\)>>](#)

2020 年执业药师《药学专业知识一》新增考点解析：

药物结构中的取代基对生物活性影响

药物结构中不同的官能团的改变可使整个分子的理化性质、电荷密度等发生变化，很多时候可以根据取代基的特性，为药物增加相应的性质或者减弱毒副作用或不良反应。

不同取代基有各自的特点，药物的改进和优化一般都是通过在不同位置上增加或者置换取代基来达成目的。

一、新增考点

取代基	影响	示例
烃基	提高脂溶性、增加脂水分配系数，降低解离度，体积较大的烷基可增加稳定性	环己巴比妥在氮原子上引入甲基后成为海索比妥，不易解离，口服后 10 分钟内即可生效
卤素	增加分子的脂溶性，增强与受体的电性结合	吩噻嗪类药物，2 位引入三氟甲基得到氟奋乃静，安定作用比 2 位氯原子取代的奋乃静强 4~5 倍
	减少药物的氧化代谢失活	醋酸氟代氢化可的松 6 位氢原子被氟取代，抗炎作用比醋酸氢化可的松强 17 倍
羟基和巯基	增加水溶性，脂肪链引入羟基，活性和毒性下降，增加解离度，增强活性和毒性	——
	巯基脂溶性比醇高，有较强的亲核性，可作为重金属的解毒药	二巯基丙醇的巯基与重金属形成络合物，用于治疗金、汞及含砷化合物的中毒
醚和硫醚	有利于药物的转运，硫醚易被氧化成亚砷或砷，砷脂溶性增大，亚砷水溶性增大	驱虫药阿苯达唑服用后在体内迅速代谢成亚砷和砷类化合物，抑制寄生虫对葡萄糖的摄取，导致寄生虫无法生存和繁殖
磺酸、羧酸和酯	引入磺酸基水溶性和解离度增加，生物活性减弱，毒性降低	抗肿瘤药物巯嘌呤难溶于水，引入磺酸基后可增加药物的水溶性
	羧酸成盐可增加水溶性，增加羧酸基团减少副作用	抗组胺药物羟嗪有中枢镇静的副作用，将羟基换成羧酸基得到西替利嗪，成为第二代没有中枢副作用的抗组胺药物
	酯类可减少对胃肠道的刺激性	头孢呋辛只能注射给药，将头孢呋辛的羧基酯化得到的前药头孢呋辛酯，脂溶性增强，口服吸收良好，半衰期也延长
含氮原子	易与核酸或蛋白质的酸性基团成盐，芳香胺有	双氯芬酸、对乙酰氨基酚，长时间和大剂量服用易导



考证就上233网校APP

报考指导、学习视频、免费题库一手掌握

潜在的毒副作用	致肝脏损伤
---------	-------

二、考情分析

取代基对药物的生理活性影响很大,在考试中属于重要考点。取代基对药物的影响,或者对人体的影响,以及相应的药物示例都是考试中考查的内容。考生们需要将各类取代基一一对应记忆。

【例题】醋酸氟代氢化可的松抗炎作用比醋酸氢化可的松强 17 倍,其原因是 6 位氢原子 ()

- A. 被磺酸取代
- B. 被巯基取代
- C. 被氮取代
- D. 被羧酸取代
- E. 被氟取代

参考答案: E

参考解析: 醋酸氟代氢化可的松 6 位氢原子被氟取代后,抗炎作用比醋酸氢化可的松强 17 倍。

执业药师刷题: 每日一练、章节练习、模拟考场、历年真题在线题库,配备老师视频解析掌上刷,另有做题记录、错题集、收藏试题、积分下载试题离线刷,以及个性化做题习惯设置,移动学习更方便!更有答题闯关,知识点打卡、模考大赛等活动边刷题边赢奖品!伴你备考路上丰富多彩!

手机应用市场搜索“233 网校”或识别下图二维码, [点击下载 233 网校 APP](#)



考证就上233网校APP

报考指导、学习视频、免费题库一手掌握