

藥物化學詳解

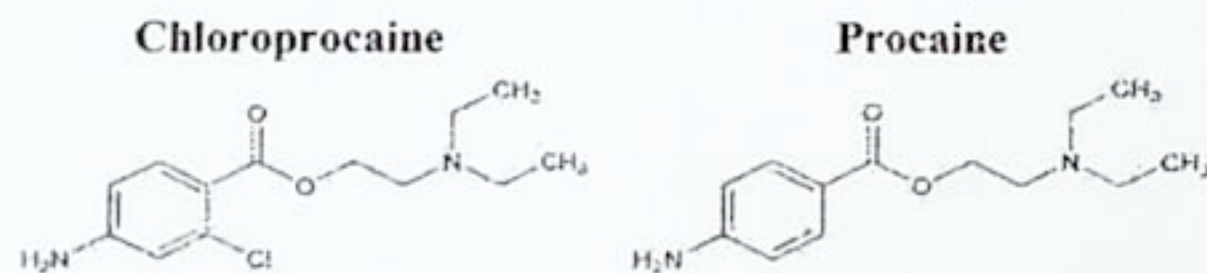
189 頁增修

C05. 下列有關chloroprocaine之敘述，何者錯誤？

- A. 屬於酯類結構
- B. 不可與磺胺藥併用
- C. 結構中的氯取代基位於苯環上羰基 (carbonyl) 之間位 (meta)
- D. 易受血漿中cholinesterase代謝

[解說]107-1 藥物化學

A. **Chloroprocaine** 是極短效作用的胺酯類 (amino-ester) 局部麻醉劑，可用於浸潤及阻斷麻醉，包括腰椎 (lumbar) 及尾椎 (caudal) 阻斷麻醉。Chloroprocaine 具有 para-aminobenzoic acid (PABA) 結構，能阻斷鈉通道。



B. **Chloroprocaine** 在體內被水解代謝，形成 4-amino-2-chlorobenzoic acid 代謝物，會抑制磺胺藥 (sulfonamides) 的抗菌作用，因此不可與磺胺藥併用。

C. **Chloroprocaine** 結構中酯鍵的羰基 (carbonyl) 之鄰位 (ortho) 的氯原子取代基會增加其親脂性 (lipophilicity)。

結構中的氯取代基位於苯環上羰基 (carbonyl) 之鄰位 (ortho)，由於會增加羰基碳 (carbonyl carbon) 的親電子 (electrophilic) 特性，而使 chloroprocaine 被血漿酯酶水解的代謝速率比 procaine 及 benzocaine 快三倍。

D. **Chloroprocaine** 及 **Procaine** 易受血漿膽鹼酯酶 (cholinesterase) 代謝，因此局部麻醉作用時間短。

藥物化學詳解

293 頁增修

C01. 下列血清胺 (serotonin) 受體中，何者屬於離子通道 (ion channel) 型？

- A. 5-HT₁
- B. 5-HT₂
- C. 5-HT₃
- D. 5-HT₄

[解說]108-1 藥物化學

血清胺 (serotonin) 受體分類

受體亞型	postreceptor	signaling effector	effect
5-HT ₁	Gi-protein	↓adenylyl cyclase	↓cAMP
5-HT ₂	Gq-protein	↑phospholipase-C-β	↑IP ₃ , DAG
5-HT₃	ion channel	↑cation ion 流入	EPSP
5-HT ₄	Gs-protein	↑adenylyl cyclase	↑cAMP
5-HT ₅	Gi-protein	↓adenylyl cyclase	↓cAMP
5-HT ₆	Gs-protein	↑adenylyl cyclase	↑cAMP
5-HT ₇	Gs-protein	↑adenylyl cyclase	↑cAMP

血清胺作用藥物

藥物	作用	用途/適應症
Sumatriptan	5-HT _{1B/1D} 受體致效劑	急性偏頭痛
Buspirone	5-HT _{1A} 受體部分致效劑	焦慮症
Flunarizine	5-HT _{1A} 致效劑 5-HT _{2A} 拮抗劑	婦女性慾低下症
Lorcaserin	5-HT _{2C} 受體致效劑	肥胖症
Ondansetron	5-HT ₃ 受體拮抗劑	止吐藥
Alosetron	5-HT ₃ 受體拮抗劑	腹瀉型腸燥症
Tegaserod	5-HT ₄ 受體致效劑	便秘型腸燥症
Cisapride	5-HT ₄ 受體致效劑	GERD
Fluoxetine, paroxetine	5-HT 再吸回抑制劑	憂鬱症