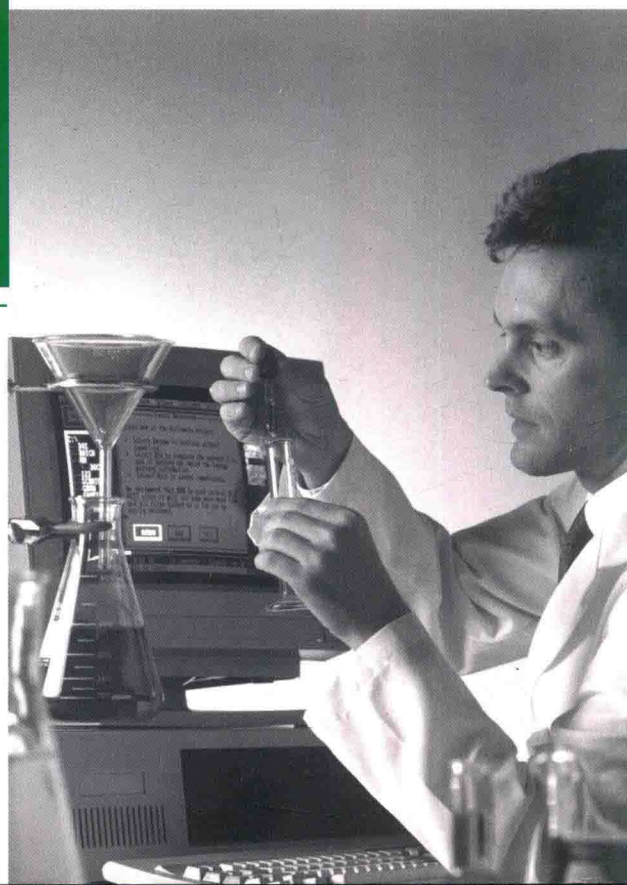




(供护理、助产及相关专业使用)
全国中等卫生职业教育规划教材

药 物 学 基 础

总主编 黄惟清
主 编 沈云帼



北京出版集团公司
北京出版社



全国中

规划教材

(供护理、助产及相关专业使用)

药 物 学 基 础

总主编	黄惟清	
主 编	沈云帼	
副主编	魏玉琴	孙文忠
编者	黄惟清	北京护士学校
	沈云帼	北京卫生学校
	降玉清	北京卫生学校
	李巧玉	北京卫生学校
	毛淑静	北京护士学校
	魏玉琴	十堰市医药科技学校
	孙文忠	仙桃职业学院
	陆桂喜	广西柳州市卫生学校
	陈 洁	广西柳州市卫生学校
	黄初冬	广西柳州市卫生学校
	张 艺	广西柳州市卫生学校

北京出版集团公司
北 京 出 版 社

图书在版编目(CIP)数据

药理学基础 / 沈云帼主编. —北京: 北京出版社,

2011.6

ISBN 978-7-200-08822-9

I. ①药… II. ①沈… III. ①药理学: 一中等专业学校
—教材 IV. ①R9

中国版本图书馆CIP数据核字(2011)第115707号

药理学基础

YAOWUXUE JICHU

主编 沈云帼

北京出版集团公司 出版
北京出版社

(北京北三环中路6号)

邮政编码:100120

网址: www.bph.com.cn

北京出版集团公司总发行

北京市通县华龙印刷厂印刷

787×1092 16开本 15.75印张 383千字

2011年6月第1版 2014年1月第4次印刷

ISBN 978-7-200-08822-9

定价: 28.50元

质量监督电话: 010-58572393 010-57176061

编审委员会

名誉主任

黄人健 原中华护理学会理事长

主任委员

黄惟清 北京护士学校校长 中华护理学会副秘书长

副主任委员

郑一宁 首都医科大学附属北京友谊医院护理部主任

刘杰 湖南中医药高等专科学校副校长

吴彬 广西中医学校校长

江乙 广西桂东卫生学校校长

卢学英 北京出版社大中专教材开发部主任

委员(以姓氏笔画为序)

王庆 北京护士学校党委书记

王丽霞 首都医科大学附属北京儿童医院

王春芳 北京卫生学校教务处主任

刘长慧 鄂州职业大学医学院

张中平 娄底市卫生学校临床教研室主任

沈云帼 北京卫生学校药剂学科药学服务组教研组长

张功勋 北京护士学校基础学科护理组组长

吴红玲 湖南中医药高等专科学校护理系主任

陈志英 广西中医学校教研室主任

张沛 北京护士学校实验中心主任

肖跃群 湖南中医药高等专科学校教授

陈善正 娄底市卫生学校

张燕京 北京卫生学校护理学科副主任

杨燕玲 黔东南民族职业技术学院基础医学部副主任

罗永富 湖南中医药高等专科学校教务处副处长

段艮芳 四川中医药高等专科学校教授

胡向莲 宁夏医科大学高等卫生职业技术学院高级讲师

高宏 宁夏医科大学高职院校副教授

莫淑蓉 柳州市卫生学校教务科科长

蒙仁 广西区人民医院附属卫生学校常务副校长

鲍淑兰 广西中医学院附设中医学校副教授

编委会办公室

温明艳 北京出版社大中专教材开发部策划编辑

出版者的话

健康是人类全面发展的基础,发展医疗卫生事业是提高人民健康水平的必然要求,医疗卫生人才是推动医疗卫生事业改革发展、维护人民健康的重要保障。教育是人才培养的摇篮,是提高人类素质的途径。中等护理职业教育是医疗卫生人才培养的重要组成部分,是培养卫生护理人才的重要方式,不仅关系到教育对象综合素质的提高、职业生涯的发展,更关系到实用型护理人才的培养、医疗卫生服务的质量,关系到护理对象的健康状况和生命安全,千家万户的幸福和民族的昌盛。为了贯彻落实教育部《全国提高职业教育教学质量的若干意见》、卫生部《关于加强卫生职业教育的指导意见》等重要文件精神,有效促进和提高中等护理专业教学质量,北京出版社组织一批行业人员和学校教师精英倾力编写了这套“技能型”中职护理精品教材。

本系列教材由 21 本基础医学、护理学和临床护理学教材组成,适用于中等护理及其相关专业的教学。本系列教材以 2007 年卫生职业教育教学指导委员会编写的《护理专业教学计划和教学大纲》、2011 年卫生部最新颁发的护士执业资格考试大纲为依据,针对中等护理专业的学生和教学特点,从临床护理岗位的人才需求出发倾力打造的,突出实用性,强化能力培养。本系列教材在内容结构上进行了大胆尝试,以“学习目标”引导学习,使学生明确学习方向;以“重点提示”强化重点,使学生学习有所侧重;以“链接”拓宽视野,使学生学习更具全面性;以“案例”导入,联系实际,使学生学习更具实用性;以“自我检测”巩固知识,使学生学习做到学练结合。

随着我国经济的飞速发展,人民群众生活水平的不断提高,人民群众对医疗卫生服务的需求愈来愈高,因此卫生部在制定的《医药卫生中长期人才发展规划(2011—2020)》中,把注册护士纳入医药卫生紧缺人才行列,并明确提出加大培养力度。注册护士人数将从目前的 218 万增至 2015 年的 286 万、2020 年的 445 万,中等护理职业学校作为培养实用型护士的专门学校,肩负着培养高素质护士人才的繁重任务。我们衷心希望本系列教材为中等护理职业教育的发展和人才的培养发挥积极的促进作用。

为了便于教师教学,本系列教材配备了多媒体教学光盘、试题库等资源。

本系列教材聘请了卫生职业教育专家、中华护理学会主要成员及卫生职业教育指导委员会的重要成员,医院一线的护理及管理人员,卫生、护理学校有经验的管理者及教师组成了教材的编审委员会。其中中华护理学会原会长黄人健担任本系列教材编审委员会名誉主

教材系列

任;北京护士学校校长黄惟清担任总主编,她同时兼任中华护理学会副秘书长、北京医学教育协会副会长、社区专业委员会主任委员、首都医科大学护理学院副院长等职;首都医科大学附属北京友谊医院护理部主任郑一宁担任副主任委员之一。编审委员会的主要成员都参与了教材指导及编写,其中大部分成员都担任主编。在此,北京出版社对他们的辛勤劳动和对出版社的大力支持表示衷心的感谢!

由于编者水平有限,教材难免有疏漏、错失之处,恳请使用本系列教材的各位专家、广大的教师和学生多多给予批评指正,使之不断完善和提高。

北京出版社

2011.6

前 言

药理学基础是中职护理及涉外护理专业的专业基础课程之一，本教材的编写以培养实用型人材为宗旨，以卫生部颁布的护理专业教学大纲及全国护士执业资格考试大纲为依据。

本教材为适应中职学生的认知水平，在编写上力求内容简洁，条理清晰，本着“必须、够用”为度的原则，减少过多的理论阐述，提高教材的适用性和实用性。通过重点提示，明确学习重点和掌握的内容；通过实例解析，激发学生的学习兴趣；通过穿插相关链接及重点提示，优化课堂教学过程，强调以学生为中心。每章配有同步测试的习题，贴近护士资格考试要求，力求体现以能力为本位，以发展技能为核心的理念，强化综合职业能力的培养。

药理学基础是运用辩证唯物主义的观点阐述药物作用的基本规律，涉及知识面广泛，通过学习本门课程，使学生能在药理学基本理论知识的指导下，完成相应的用药护理综合性专业技能课程，并运用在实际中。在编写中我们坚持三基原则（基本理论、基本知识、基本技能），结合护理专业的特点和临床实际用药，重点介绍各类药物的作用、适应证、不良反应及用药护理，注重培养学生分析问题，解决问题的能力，使学生在药理学的学习上与护士资格考试紧密结合，调动学生学习的积极性和主动性。

本书的药物名称一律按国家药典规定，对各药物不再介绍药物的剂型及用法。

本教材的编写，得到各位编者所在学校及出版社的大力支持，在此一并表示衷心的感谢。

由于编写时间仓促以及编者水平有限，书中欠妥和疏漏之处在所难免，敬请各位专家和广大读者提出宝贵意见。

编者

目 录

第一章 药理学基础总论	1
第一节 概述	1
第二节 药物对机体的作用——药效学	3
第三节 机体对药物的影响——药动学	7
第四节 影响药物作用的因素	14
自我检测	19
第二章 传出神经系统药物	20
第一节 概述	20
第二节 胆碱受体激动药和胆碱酯酶抑制药	25
第三节 抗胆碱药	29
第四节 拟肾上腺素药	34
第五节 抗肾上腺素药	39
自我检测	43
第三章 局部麻醉药物	44
自我检测	48
第四章 中枢神经系统药物	50
第一节 镇静催眠药	50
第二节 抗癫痫药	54
第三节 抗精神失常药	57
第四节 镇痛药	62
第五节 解热镇痛抗炎药	67
第六节 中枢兴奋药	71
自我检测	73
第五章 心血管系统药物	75
第一节 抗高血压药	75
第二节 抗慢性心功能不全药	84
第三节 抗心律失常药	88
第四节 抗心绞痛药	93
第五节 调血脂药	97
自我检测	101
第六章 泌尿系统药物	102
第一节 利尿药	102

第二节 脱水药	108
自我检测	109
第七章 血液和造血系统药物	110
第一节 抗贫血药	110
第二节 促凝血药	114
第三节 抗凝血药和溶栓药	117
第四节 血容量扩充药	120
第五节 盐类及酸碱平衡调节药	122
自我检测	124
第八章 呼吸系统药物	126
第一节 镇咳药	126
第二节 祛痰药	129
第三节 平喘药	131
自我检测	136
第九章 消化系统药物	138
第一节 助消化药	138
第二节 抗消化性溃疡药	139
第三节 止吐药及胃肠动力药	144
第四节 泻药与止泻药	146
自我检测	148
第十章 抗组胺药	150
自我检测	153
第十一章 子宫兴奋药	154
自我检测	158
第十二章 激素类及有关药物	160
第一节 肾上腺皮质激素类药物	160
第二节 甲状腺激素和抗甲状腺药物	164
第三节 降血糖药	169
自我检测	175
第十三章 抗微生物药	177
第一节 概述	177
第二节 抗生素	179
第三节 合成抗菌药	192
第四节 抗结核病药	197
第五节 抗真菌药和抗病毒药	200
第六节 消毒防腐药	203
自我检测	207

第十四章 抗肿瘤药物	209
第一节 概述	209
第二节 常用抗肿瘤药	212
自我检测	222
实践指导	224
实践一 药物的一般知识	224
实践二 调配操作练习及溶液浓度和剂量计算	227
实践三 药物的相互作用	228
实践四 不同给药途径对药物作用的影响	228
实验五 药物剂量对药物作用的影响	229
实践六 传出神经药对血压的影响	230
实践七 传出神经系统药对兔瞳孔的影响	230
实践八 局麻药的毒性比较	231
实践九 镇静催眠药的应用及用药护理	232
实践十 镇痛药及解热镇痛药的应用及用药护理	232
实践十一 抗高血压药的应用及用药护理	233
实践十二 抗贫血药的应用及用药护理	234
实验十三 糖皮质激素的应用及用药护理	235
实践十四 抗菌药的应用及用药护理	236
实践十五 链霉素毒性反应及钙剂的对抗作用	237
参考答案	238
参考文献	240

第一章



药理学基础总论

学习目标

1. 掌握药理学的基本概念。
2. 熟悉药物的体内过程及影响药物作用的因素。
3. 了解药物的作用机制。

人类的历史包括许多方面，哲学的、人文的、科学的，而且凡是古代文明发达的国家，其医药的起源都很早。在药理学发展的历史中，我们都知道神农尝百草的故事；知道世界药理学史上伟大的著作《本草纲目》；知道弗莱明的细菌培养皿偶然不慎被霉菌污染而发现了青霉素的故事；知道由于第二次世界大战中芥子毒气罐泄漏而发现抗癌药氮芥。由此可见，药物是人类必不可少的东西，但俗语常说“是药三分毒”，而护士是各种药物治疗的实施者，也是用药前后的监护者，因此为了患者的用药安全，我们有必要学习药理学的基本知识。

第一节 概 述

预习案例

案例 1-1：请问身体非常好、从没有去过医院、也自认为没有吃过药的人存在吗？我们注射的预防针是属于什么类的药物？

思考：药物的定义是什么？

一、药物和药理学概念

药物是用于预防、治疗、诊断疾病和计划生育的化学物质。其来源可分为天然药物和人工合成药物两大类，天然药物来自植物、矿物、动物或由生物技术制备等；人工合成药物系采用现代科技手段人工化学合成。

药理学是研究药物的作用、临床应用、不良反应及用药护理等内容的一门科学。其研究内容包括两个方面：一是研究药物对机体的作用，称为药物效应动力学，简称药效学；二是研究机体对药物的影响，即研究药物的体内过程，包括吸收、分布、生物转化和排泄，称为药物代谢动力学，简称药动学。通过对药效学和药动学的研究，为临床防治和护理疾病提供理论依据。

重点提示

掌握药物的概念是学习的基础，概念中的四个方面是指预防、治疗、诊断疾病和计划生育。

二、护士学习药理学的方法和目的

护士在临床第一线工作，服务对象是病人，医嘱制定之后，护士是药物治疗的直接实施者，也是用药前后的监护者。因此护士在临床药物治疗中占有重要地位，直接影响到药物治疗的效果。

1. 学习目的

基本掌握药理学知识，能够说出药物的作用、临床应用、不良反应及防治、用药护理、配伍禁忌等。在临床护理工作中，按照护理程序正确执行处方医嘱、观察药物疗效，并能协助医生制定和调整药物治疗方案，监护不良反应，实施健康教育，防止和减少药源性疾病和药疗事故的发生，以确保患者临床用药安全有效，减轻病人痛苦，促进病人康复，并达到最佳治疗效果。

2. 学习方法

首先，要掌握重点药物或代表性药物的特点，药物的分类是重点学习的内容，由此可以掌握同类药物的共同规律，并予以归纳总结同类药物的共性和单个药物的个性。其次，在学习过程中还要注意与相关医学课程知识的联系，以加深理解、促进记忆、巩固知识，最终达到学习目标。最后，在学习中还应注意以下几点：

(1) 在执行医嘱前，应了解患者的诊断和病情，明确用药目的，掌握所用药物的药理作用、给药途径、剂量、用法、不良反应及其防治措施等。

(2) 护士应严格按医嘱给病人用药，若对医嘱有疑问时，应先与医生联系后再执行。

(3) 在执行用药医嘱时，要做到明确医嘱目的，准确掌握剂量和用法，避免技术性事故发生，以提高护理质量。

(4) 用药前，应先核对病人姓名、年龄、性别、床号、诊断，并查对用药剂量和用法。虽然目前护士没有处方权，但对药疗有监护责任。

(5) 注意正确分配服药时间和指导病人服药。不少药物的疗效与给药时间密切相关，护士应了解如何科学地安排服药时间；饮食也会影响药效，因此在用药期间，亦应注意向病人介绍有关饮食注意事项，指导病人正确配合治疗，以提高药物疗效，减少毒副反应。

(6) 在病人用药期间，应注意观察药物的疗效和不良反应，做好记录，并主动询问和检查有关症状，以便能及时发现问题和处理，避免药源性疾病的发生。

(7) 对不熟悉的药物，在用药前应查阅书籍，了解其药理作用、不良反应、药物配伍禁忌和护理注意事项等。

(8) 在整个药物治疗过程中，护士有责任随时指导病人合理用药，在患者出院时也应向病人及其家属讲解所带药物的有关知识，特别是一些常见不良反应和注意事项，以保证出院后继续用药的安全有效。

 链接

护士在药物治疗中要严格执行“三查七对”，具体内容是：三查：操作前、操作中、操作后；七对：对床号、姓名、药名、浓度、剂量、方法、时间。

第二节 药物对机体的作用——药效学

 预习案例

案例 1-2：患者，因为胃痉挛，口服阿托品治疗，用药时患者会感到口干。

思考：能说出原因吗？

药效学是研究药物对机体的作用及相关因素的一门科学，为临床选择用药提供主要理论依据。

一、药物的基本作用

药物对机体（包括病原体）功能活动的影响，称为药物的基本作用，尽管药物的种类繁多，作用各异，但其作用均是在机体原有生理生化功能的基础上产生的，其表现为兴奋和抑制。凡是能使机体器官组织原有生理生化功能提高的作用称为兴奋作用，如肾上腺素使心肌收缩力加强，心率加快等；反之，凡能使机体器官组织原有功能活动减弱的作用称为抑制作用，如吗啡产生镇痛和呼吸抑制，苯巴比妥产生镇静催眠作用等。所以，兴奋和抑制是药物作用的基本表现，二者在一定条件下是可以相互转化的，过度兴奋，则可导致衰竭性抑制，甚至死亡。

二、药物作用的基本类型

（一）局部作用和吸收作用

局部作用是指药物未被吸收入血之前，在用药局部所呈现的作用，如酒精、碘酒对皮肤黏膜表面的消毒作用；局麻药的局部麻醉作用；口服碳酸氢钠的中和胃酸作用等。吸收作用是指药物进入血液循环后，分布到组织器官所产生的作用，如硝酸甘油的抗心绞痛作用，对乙酰氨基酚的解热镇痛作用。

（二）选择作用

药物吸收入血分布于各组织器官，但并不是对所有的组织器官都能产生同样的作用，在一定剂量下，机体各组织器官对药物敏感性的差异，称为药物作用的选择性或药物的选择作用。产生选择性的原因与药物和组织的亲和力、组织器官对药物的敏感性及药物在体内的分布等因素有关。

选择性高的药物针对性强，在治疗剂量时，往往只对某个组织器官有明显作用，而对

其他组织无作用或作用不明显。如强心苷可选择性地加强心肌收缩力，而对平滑肌和骨骼肌无作用。选择性低的药物作用范围广泛，可影响机体多个组织器官的功能，适应证多，但不良反应也多。如阿托品通过阻断M受体，可产生心脏、内脏平滑肌、腺体、眼等M样作用，当利用松弛平滑肌作用治疗胃肠绞痛时，口干、心悸、视物模糊则为其不良反应。但选择性低的药物，如广谱抗菌药，在用于多种细菌感染性疾病治疗时，也有其优越性。

由于大多数药物都具有各自的选择作用，所以药物均具有各自的适应证和不良反应，这就成为药物分类的依据和临床选择用药的基础。

链接

与选择作用相反，有的药物对机体的各组织器官都产生类似的作用，可影响酶的活性，干扰组织细胞的代谢甚至引起细胞原生质变性，这种作用称为普遍细胞作用，又称原生质毒，是不可用于体内的，仅作为消毒药用于体外杀菌。

（三）防治作用和不良反应

药物的作用具有两重性，既可呈现对机体有利的防治作用，又可产生对机体不利的不良反应。

1. 预防作用

在疾病发生之前用药，以防止疾病或症状的发生，称为预防作用，如接种疫苗等。

2. 治疗作用

根据用药目的不同，治疗作用可分为对因治疗和对症治疗。

（1）对因治疗：用药目的在于消除原发致病因素，彻底治愈疾病，称为对因治疗，如青霉素G杀灭革兰阳性菌感染。

（2）对症治疗：用药目的在于缓解或消除疾病的症状，称为对症治疗，如失眠病人服用催眠药，高血压病人服用降压药等。对症治疗虽不能消除病因，但在某些情况下也是非常重要的，如休克、高热、惊厥时，必须立即给予对症治疗，以防病情恶化，为对因治疗争取时间。

3. 不良反应

用药后产生与治疗目的无关的其他作用，统称为不良反应，任何药物都有一定的不良反应。

（1）副作用：指药物在治疗量时出现的与治疗目的无关的作用，一般症状较轻。多由于药物选择性低，作用于多个效应器官，当某一效应为治疗目的时，其他效应则为副作用。每个药物的副作用和治疗作用不是固定不变的，常随着治疗目的不同而转化。如麻黄用于平喘的同时出现中枢兴奋作用，引起失眠为副作用。如利用阿托品的平滑肌松弛作用治疗腹痛的同时，出现口干等副作用，然而全身麻醉时，又选用阿托品的抑制腺体分泌作用为治疗作用。副作用一般危害不大，且可以预知，故只需适当对症进行处理。在临床给药时护士可将可能发生的副作用告诉病人，以免病人恐惧。

（2）毒性反应：一般是由于用药剂量过大或用药时间过长或病人对药物的敏感性过高

而引起的对机体有明显损害甚至危及生命的反应。如长期或大剂量应用链霉素引起的听神经损害等。在用药后即可发生的毒性反应称为急性毒性反应,由于长期用药,药物在体内逐渐蓄积发生的毒性反应,称为亚急性或慢性毒性反应,如药物的致癌、致畸胎、致突变反应(三致反应)即为慢性毒性反应。毒性反应可以预知,故在临床用药时,应严格掌握剂量和疗程,以避免或减少毒性反应的发生。

(3) 变态反应:又称为过敏反应,是指少数致敏的机体用药后产生的一种病理性免疫反应。此反应与用药剂量无关,与毒性反应不同,不易预知,致敏原可以是药物及药物在体内的代谢产物或制剂中的杂质等。故在用药前应详细询问病人有无药物过敏史,有的药物用前需作过敏试验,并预先作好抢救准备,对曾有该药过敏史或过敏试验阳性者应禁用。

重点提示

药物的副作用、毒性反应、变态反应是药物最重要的三个不良反应,要知道并理解定义及其特点。

(4) 后遗效应:指停药后血药浓度已降到阈值以下时所残存的药物效应,这种效应可以很短暂,也可以较持久。如夜间服用长效巴比妥类镇静催眠药,经过一夜,药物在体内虽然大部分消除,但次晨起床后仍可有嗜睡、头脑不清醒、乏力等短暂宿醉现象。

(5) 继发反应:指药物治疗作用所产生的不良后果,又称为治疗矛盾,如长期应用广谱抗生素后,体内对药物敏感菌被抑制或杀灭,不敏感菌则大量繁殖生长,导致菌群失调引起新的感染,被称为二重感染,引起如白色念珠菌或抗药葡萄球菌等继发感染,即属于继发反应。

链接

药物依赖性,指某些药物连续应用后,药物与机体相互作用造成的一种精神状态,有时也包括身体状态,表现为强迫性使用或定期使用该药的行为和其他反应,目的是体验其欣快感或避免由于停药引起的不适。可以发生或不发生耐受性。药物依赖性可分为精神依赖性和身体依赖性。

精神依赖性又称为心理依赖性或习惯性,是指连续用药,突然停药后,病人产生继续用药的强烈欲望,并产生强迫性用药行为,以求获得满足或避免不适。易产生精神依赖性的药物如某些催眠药等。

身体依赖性又称为生理依赖性 or 成瘾性,是指反复用药后,一旦停药就会出现戒断症状,表现为烦躁不安、流泪、出汗、疼痛、恶心、呕吐、惊厥等,甚至危及生命。身体依赖者为求得继续用药,可不择手段,甚至丧失道德人格。易产生身体依赖性的药物如吗啡、哌替啶等,被称为“麻醉药品”,我国于1978年颁布实施《麻醉药品管理条例》,该条例对此类药品的保管和使用等均有严格的规定,凡接触“麻醉药品”的医护人员都应严格遵守,以防滥用造成严重后果。

药物依赖性产生后,不但影响用药者的身心健康,还可以带来社会危害。因此,医护人员在给病人使用这类药物时,需特别慎重。

三、药物的作用机制

药物作用机制阐明的是药物为什么能起作用以及如何起作用,有助于理解药物作用和不良反应的本质,为提高药物疗效和防止不良反应,安全、合理用药提供理论依据,从而

提高护理用药的质量。

1. 参与或干扰细胞代谢

如铁剂、碘、激素类药物可参与机体细胞代谢过程，用于相应疾病的治疗；而氟尿嘧啶可干扰肿瘤细胞蛋白质合成而发挥抗肿瘤作用。

2. 影响细胞膜离子通道

如利多卡因影响心肌 Na^+ 通道而治疗室性心律失常。

3. 影响酶的活性

如阿司匹林抑制前列腺素合成酶，用于解热镇痛抗炎抗风湿；新斯的明可抑制胆碱酯酶的活性，用于重症肌无力的治疗。

4. 影响递质的释放或激素的分泌

如麻黄碱促进交感神经末梢释放去甲肾上腺素，引起血压升高；大剂量碘可抑制甲状腺素的分泌，用于甲亢危象治疗。

5. 改变细胞周围的理化环境

如碳酸氢钠中和胃酸；甘露醇改变血浆渗透压有脱水作用，可用于降低颅内压。

6. 影响递质的释放或激素的分泌

如麻黄碱促进去甲肾上腺素递质的释放等。

7. 药物与受体结合

根据近代分子生物学和生物化学的研究认为，大多数药物是通过与细胞上某些大分子蛋白质（受体）相结合而产生作用。一般药物与相应受体结合后先形成复合物，然后通过复合物的作用，激活细胞其他成分产生效应。

药物与受体结合产生效应，须具备两个条件：一是药物与受体相结合的能力即亲和力；二是内在活性，即药物能产生效应的能力。由此可将药物分为三类：

（1）激动剂：指药物与受体有较强的亲和力，并有较强的内在活性，它能兴奋受体产生明显效应，如吗啡激动阿片受体引起镇痛作用。

（2）拮抗剂：指药物与受体亲和力很强，但没有内在活性，故不能引起效应，但能阻断激动剂和受体的结合，与激动剂有对抗作用，如纳洛酮本身无明显药理效应，但在体内和吗啡竞争同一受体，具有对抗吗啡的药理作用。

（3）部分激动剂：本类药物与受体有亲和力，但只有弱的内在活性，因此单独应用时能产生较弱的效应，而与激动剂合用时，则表现出对抗激动剂的作用，即削弱激动剂的效应，所以部分激动剂具有激动剂和拮抗剂的双重特性，如喷他佐辛即属此类。

重点提示

受体激动剂和受体拮抗剂的定义是要记忆的内容，其关键点是亲和力和内在活性的问题。

第三节 机体对药物的影响——药动学

预习案例

案例 1-3：口服的药物是如何进入血液循环的，请画出线路图。

思考：在这个过程中都经过了哪些结构？

药动学是研究药物的体内过程及体内药物浓度随时间变化规律的一门科学。其借助动力学原理及数学计算方法研究体内药物浓度的变化过程，从而阐明药物吸收、分布、生物转化和排泄的特点，为临床制定正确的用药方案提供依据。

一、药物的跨膜转运

药物通过生物膜的过程称为药物跨膜转运，如图 1-1 所示，药物在体内的转运如吸收、分布、排泄均需通过组织细胞的生物膜，药物通过生物膜的形式主要有被动转运和主动转运两种方式。

（一）被动转运

为不耗能的顺浓度差转运，药物从高浓度侧向低浓度侧转运，膜两侧浓度差越大，药物转运的速度越快。被动转运有以下类型：

1. 简单扩散

简单扩散又称脂溶扩散。多数药物以此种方式转运。

2. 膜孔扩散

膜孔扩散又称滤过。小分子水溶性药物可通过细胞膜的膜孔扩散。

3. 易化扩散

易化扩散包括不耗能的载体转运和离子通道转运。

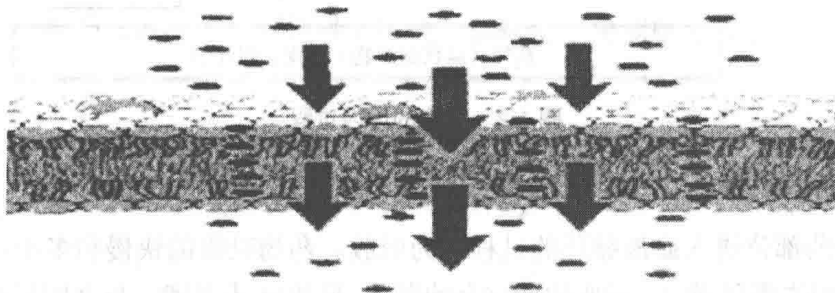


图 1-1 药物的跨膜转运