

药 理 学

(試用教材)

福 建 医 科 大 学

一九七四年七月

毛主席语录

教育必須为无产阶级政治服务，必須同生产劳动相結合。

改革旧的教育制度，改革旧的教学方针和方法，是这场无产阶级文化大革命的一个极其重要的任务。

把医疗卫生工作的重点放到农村去。

中国医药学是一个伟大的宝库，应当努力发掘，加以提高。

讀書是学习，使用也是学习，而且是更重要的学习。

目 录

第一章 总论	1
一、为创建我国统一的新医学，新药学而奋斗！	2
一、药物作用的基本规律	2
第二章 镇静催眠药	6
第一节 巴比妥类	7
第二节 利眠宁、安定与眠尔通	10
利眠宁(10)安定(10)眠尔通(安宁)(11)	
第三节 其他类型的镇静催眠药	11
水合氯醛(11)安眠酮(12)溴化物(12)	
第四节 中草药	13
酸枣仁(13)首乌藤(13)柏子仁(13)合欢皮(13)	
第三章 抗惊厥药与抗癫痫药	14
第一节 抗惊厥药	14
硫酸镁(14)	
第二节 抗癫痫药	15
苯妥英钠(大仑丁)(15)去氧苯巴比妥(扑痫酮、密苏林)(16)	
乙琥胺(16)	
第三节 中草药	17
天麻(17)钩藤(17)僵蚕及僵蛹(18)蜈蚣(18)	
第四章 安定药	18
氯丙嗪(冬眠灵)(18)奋乃静(羟哌氯丙嗪)(21)	
三氟拉嗪(21)泰尔登(22)	
附 谷维素	23
第五章 镇痛药	23
吗啡(23)哌替啶(度冷丁)(24)阿那度(安侬痛)(25)延胡索乙素	
及颅通定(25)芬太尼(25)七叶莲(鹅掌藤、汉桃叶)(26)	
第六章 解热镇痛，抗风湿药和解衰药	26
第一节 解热镇痛，抗风湿药	26
一、水杨酸类	28
阿斯匹林(28)	
二、苯胺类	29
非那西汀(29)醋氨酚(扑热息痛、退热净)(30)	

三、吡唑酮类.....	30
氨基比林(匹拉米洞)(30)安乃近(31)保太松(布他酮)(31)	
羟基保太松(32)	
四、灭酸类.....	32
氯灭酸(抗炎灵、抗风湿灵)(32)	
五、解热镇痛药的复方配伍.....	32
第二节 祛风湿中草药.....	33
汉防己(34)秦艽(35)穿山龙(34)独活(34)豨签草、臭梧桐(35)	
第三节 解表药.....	35
麻黄(35)柴胡(36)葛根(36)	
第七章 中枢兴奋药.....	37
尼可杀米(可拉明)(37)回苏灵(37)咖啡因(37)洛贝林(山梗菜硷)	
及野靛硷(38)戊四氮(卡地阿唑、戊四唑)(38)	
第八章 作用于传出神经末梢部位的药物概述.....	39
一、传出神经的解剖分类.....	39
二、传出神经的介质和受体.....	40
三、传出神经按介质的分类.....	40
四、传出神经的生理功能.....	40
五、作用于传出神经末梢部位的药物.....	42
第九章 拟胆硷药.....	43
第一节 主要用于缩瞳的拟胆硷药.....	44
匹鲁卡品(毛果芸香硷)(44)毒扁豆硷(45)	
第二节 主要用于兴奋平滑肌和骨骼肌的拟胆硷药.....	45
新斯的明(45)加兰他敏(45)氨甲酰胆硷(46)	
第十章 有机磷酸酯类及其解毒药.....	46
第一节 有机磷酸酯类.....	46
第二节 胆硷酯酶复活剂.....	48
解磷定(解磷毒、辟磷毒、派姆、醛肟吡铵)(48)	
氯磷定(49)双复磷(49)	
第十一章 抗胆硷药.....	49
第一节 平滑肌解痉药.....	50
阿托品(50)山莨菪硷(654)(52)普鲁本辛(52)东莨菪硷(53)	
第二节 抗震颤麻痹药.....	53
盐酸苯海索(安坦)(53)左旋多巴(L—多巴)(53)	
第十二章 拟肾上腺素药及抗肾上腺素药.....	55
第一节 拟肾上腺素药.....	55
一、概述.....	55
二、作用于 α 及 β 受体的拟肾上腺素药.....	57

肾上腺素(57)麻黄碱(58)	
三、主要作用于 α 受体的拟肾上腺素药	58
去甲肾上腺素(58)间羟胺(阿拉明)苯肾上腺素(新福林)(59)	
四、作用于 β 受体的拟肾上腺素药	59
异丙肾上腺素(59)	
五、其他	60
多巴胺(60)	
第二节 抗肾上腺素药	61
妥拉苏林(苄唑啉)(61)酚妥拉明(立其丁、苄胺唑啉)(61)	
第十三章 抗高血压病药(降压药)	62
一、抗肾上腺素能神经药	63
利血平(血安平)(63)降压灵(64)胍乙啶(64)	
二、直接松弛血管平滑肌的降压药	64
肼苯哒嗪和双肼苯哒嗪(血压达静)(64)地巴唑(65)	
三、利尿降压药	65
双氢氯噻嗪(双氢克尿塞)(65)	
四、神经节阻断药	65
五、降压中草药	66
猪毛菜(66)臭梧桐(八角梧桐、海州常山)(66)杜仲(67)	
六、其他降压药	67
α -甲基多巴(爱道美)(65)优降宁(巴吉林)(67)可乐宁(氯压定)(68)	
附 高血压病的分期标准	69
第十四章 作用于消化系统药物	70
第一节 抗酸药	70
碳酸钙(70)氢氧化铝(71)碳酸氢钠(71)三硅酸镁(71)	
第二节 助消化药	71
稀盐酸(71)胃蛋白酶(72)胰酶(72)药曲(旧名神曲)(72)	
山楂(72)谷芽和麦芽(72)乳酶生(表飞鸣)(73)	
第三节 泻药	73
一、化学刺激性泻药	73
双醋酚汀(一轻松)和三醋酚汀(通畅)(73)大黄(73)	
二、机械刺激性泻药	73
硫酸镁及硫酸钠(73)	
三、润滑性泻药	74
火麻仁和郁李仁(74)液体石蜡(74)甘油(74)	
第四节 止泻药	74
鞣酸类(74)次碳酸铋(75)药用炭(75)复方樟脑酊(75)	
第五节 肝脏疾病的辅助用药	75

一、中草药.....	75
茵陈(75)板兰根(75)垂盆草(76)田基黄(76)	
二、维生素B类.....	76
三、抗脂肪肝药.....	76
四、葡萄糖、3—磷酸腺苷(ATP)和肌苷.....	76
五、肝太乐(葡萄糖醛酸内酯).....	76
六、降低血氨的药物.....	77
第十五章 祛痰、止咳、平喘药.....	78
第一节 祛痰药.....	78
氯化铵(79)桔梗和远志(79)粘痰溶解剂: N—乙酰半胱氨酸 (易咳净、痰易净)(79)溴苄环己铵(必嗽平)(79)	
第二节 止咳药.....	79
可待因(80)咳必清和咳美芬(80)满山红(兴安杜鹃)(80) 矮地茶(紫金牛)(80)	
第三节 平喘药.....	80
肾上腺素(80)麻黄硷(81)异丙肾上腺素(81) 氨茶硷(81)肾上腺皮质激素(82)	
第十六章 强心甙.....	83
第十七章 抗心律失常药.....	89
奎尼丁(90)普鲁卡因酰胺(90)利多卡因(91)苯妥英钠(91) 心得安及心得宁(91)钾盐(氯化钾)(92)	
第十八章 抗心绞痛药.....	93
硝酸酯类(93) β —肾上腺素受体阻滞剂(94)心可定(95) 毛冬青(95)丹参(96)	
第十九章 利尿药和脱水剂.....	96
第一节 利尿药.....	96
双氢氯噻嗪及其类似物(99)速尿(呋喃苯氨酸、腹安酸)(100)利尿酸 (100)安体舒通(螺旋内酯固醇)(100)氨苯喋啶(三氨喋呤)(101)汞撒 利(撒利汞)(101)	
第二节 脱水剂.....	102
甘露醇(102)山梨醇(103)高渗葡萄糖溶液(103) 具有利尿作用的中草药.....	104
茯苓(104)猪苓(104)泽泻(104)车前草(104)	
第二十章 作用于血液与造血系统的药物.....	105
第一节 止血药.....	105
维生素K(105)安络血(安特诺新)(106)凝血质(106)垂体后叶素(106) 6—氨基己酸(106)对羧基苄胺(抗血纤溶芳酸)(107)止血环酸(凝血 酸、反式对氨基甲基环己酸)(107)仙鹤草及紫珠草(107)	

第二节	抗凝血药.....	108
	肝素(108)枸橼酸钠(108)	
第三节	治疗贫血药.....	109
	铁盐(109)叶酸(110)维生素B ₁₂ (氰钴胺)(110)	
第四节	促进白细胞增生药.....	111
	维生素B ₄ (6-氨基嘌呤磷酸盐)(111)维生素B ₆ (盐酸吡多辛)(112)	
	维生素B ₁₂ 及叶酸(112)脱氧核糖核苷酸(112)鲨肝醇(112)L-半胱氨酸(112)中草药(112)	
第五节	血容量扩张药.....	113
	右旋糖酐(113)	
第二十一章	子宫收缩药.....	114
	催产素和垂体后叶素(114)麦角新碱(115)	
	中草药.....	116
	益母草(116)当归(116)马齿苋(116)	
第二十二章	抗过敏药.....	116
一、	抗组织胺药.....	117
二、	钙盐.....	117
第二十三章	肾上腺皮质激素类药物.....	118
附	促肾上腺皮质激素(ACTH).....	124
第二十四章	治疗甲状腺机能亢进药物.....	125
	硫脲类药物(125)	
	碘及碘化物(127)	
	黄独(128)	
第二十五章	抗糖尿病药.....	128
一、	胰岛素.....	128
二、	口服降血糖药: 甲苯磺丁脲(甲糖宁、D860)(130)苯乙双胍(降糖灵、DBI)(131)	
	中草药: 地黄(131)	
第二十六章	维生素制剂.....	132
第一节	水溶性维生素.....	132
	维生素B ₁ (132)维生素B ₂ (133)烟酰胺和烟酸(133)维生素B ₆ (134)	
	维生素C(134)路丁(134)	
第二节	脂溶性维生素.....	135
	维生素A(135)维生素D(135)	
第二十七章	磺胺类和呋喃衍化物.....	136
第一节	磺胺类.....	136
附	甲氧苄氨嘧啶(抗菌增效剂、TMP).....	143
第二节	呋喃类.....	143

第二十八章 抗菌素	144
一、抗菌素的作用原理	144
二、抗菌素的分类	145
第一节 主要用于革兰氏阳性细菌感染的抗菌素	146
青霉素类(146)半合成青霉素类(148)先锋霉素(头孢菌素)类(148)	
红霉素(149)	
第二节 主要用于革兰氏阴性细菌感染的抗菌素	(150)
氨基糖甙类抗菌素: 链霉素和双氢链霉素(151)庆大霉素(152)卡那霉素(152)	
多粘菌素类(152)	
创新霉素(153)	
第三节 广谱抗菌素	154
四环素类(154)氯霉素和合霉素(156)	
第四节 抗真菌抗菌素	157
灰黄霉素(157)制霉菌素(158)克霉唑(抗真菌一号、三苯甲咪唑)(158)	
第五节 抗菌的中草药	158
黄连(159)金银花(159)连翘(159)板兰根及大青叶(160)穿心莲(榄核莲,一见喜)(160)四季青(160)鱼腥草(161)	
第六节 抗菌药物临床应用的注意问题	161
一、正确选用抗菌药物	161
二、联合用药问题	162
第二十九章 抗结核病药	164
一、第一线抗结核药	165
异烟肼(雷米封)(165)链霉素(166)对氨基水杨酸(166)	
二、第二线抗结核药	167
氨硫脲(结核胺)(167)乙硫异烟胺(167)利福平(167)乙胺丁醇(167)	
其他抗结核药(168)	
结核病的化学治疗原则	168
第三十章 抗疟药	169
一、主要控制症状的抗疟药	170
氯喹(氯化喹啉)(170)奎宁(171)阿的平(171)常山(172)	
二、控制复发及防止传播的抗疟药	172
伯氨喹(172)	
三、主要用于预防的抗疟药	173
乙氨嘧啶(息疟定)(173)环氯胍(173)	
四、抗疟药的应用近况	173
第三十一章 抗阿米巴病药和抗滴虫病药	176
第一节 抗阿米巴病药	176

	噻碘方(安痢生、药特灵)(176)卡巴肿(176)白头翁(177)鸦胆子(177)	
	大蒜(177)四环素类(177)巴龙霉素(178)吐根硷(依米丁)(178)甲硝哒唑	
	(灭滴灵)(178)氯喹(178)	
第二节	抗滴虫病药.....	179
	甲硝哒唑(179)乙酰肿胺(滴维净)(179)蛇床子(179)	
第三十二章	抗血吸虫病药及抗丝虫病药.....	180
第一节	抗血吸虫病药.....	180
	锑剂(181)血防—846(六氯对二甲苯)(183)呋喃丙胺(F—30066)(184)	
	南瓜子(184)	
第二节	抗丝虫病药.....	184
	海群生(乙胺嗪)(184)	
第三十三章	抗肠虫药.....	185
第一节	抗蛔虫蛲虫药.....	185
	哌嗪(驱蛔灵)(185)四咪唑(驱虫净)(186)山道年(186)苦楝皮、使君	
	子、鹧鸪菜(美舌藻)(186)酸性药物(187)	
第二节	抗钩虫药.....	187
	酚乙铵(灭虫宁)(187)四氯乙烯(187)噻嘧啶(187)	
第三节	抗绦虫药.....	188
	槟榔和南瓜子(188)鹤草芽(188)氯硝柳胺(灭绦灵)(188)	
第三十四章	抗恶性肿瘤药物.....	190
第一节	抗癌药物的作用原理.....	190
第二节	细胞繁殖动力学与恶性肿瘤化学治疗.....	192
第三节	抗代谢药物.....	193
	5—氟尿嘧啶(193)阿糖胞嘧啶(193)6—巯基嘌呤(193)氨甲喋呤(193)	
第四节	烷化剂(烷化剂).....	194
一、	氮芥类药物.....	194
	氮芥(194)氮甲(194)合一—14(抗瘤氨酸)(194)甲氧芳芥、消瘤芥(195)	
	环磷酰胺(195)氧氮芥(195)	
二、	非氮芥的烷化剂.....	195
	噻替派(195)马利兰(195)	
第五节	中草药.....	195
	长春花(196)喜树(196)	
第六节	抗菌素类.....	196
	更生霉素(放线菌素D)(196)自力霉素(丝裂霉素C)(196)	
	争光霉素(博来霉素)(197)	
第七节	激素类药物.....	197
	雄激素(197)雌激素(197)黄体激素(197)肾上腺皮质激素(197)	
附	免疫抑制剂.....	199

第一章 总 論

药物是用以预防、治疗和诊断疾病的物质，包括天然药物（植物、动物和矿物）与化学合成的药物。

药理学的主要任务是研究机体在药物影响下发生的变化，机体对药物的改变以及这些变化的规律和道理，以便在实践中充分发挥药物的疗效，避免不良反应。

一、为创建我国统一的新医学，新药学而奋斗！

药物是人类同疾病斗争的工具之一。自古以来，我国劳动人民通过实践积累了极其丰富的经验，汉代（公元前1～2世纪）“神农本草”记载药物365种，明代李时珍著的“本草纲目”收编的药物达1892种，被译为英、日、德、法、俄及拉丁文，对世界医药学作出了重要贡献。

伟大领袖毛主席十分关心祖国新医药学的发展，早在工农红军时期就提出：“用中西两法治疗”疾病；建国初期，又发出了“团结新老中西各部分医药卫生工作人员，组成巩固的统一战线，为开展伟大的人民卫生工作而奋斗”的号召；1958年毛主席又指出：“中国医药学是一个伟大的宝库，应当努力发掘，加以提高，”为我国医药学的发展，指明了航向。

刘少奇、林彪推行反革命修正主义路线，猖狂对抗毛主席的指示，以民族虚无主义对待祖国医药遗产，排挤中医中药，压制、扼杀中西医结合的群众运动，严重地阻碍了我国新医药学的发展。

史无前例的无产阶级文化大革命，彻底摧毁了刘少奇、林彪这两个资产阶级司令部，进一步批判民族虚无主义和“洋奴哲学”，声讨他们破坏中西医结合的罪行。毛主席的无产阶级卫生路线更加深入人心，西医学中医，中西医结合的群众运动蓬勃展开，广大工农兵群众和革命的医药人员在毛主席“六·二六”光辉指示鼓舞下，大搞中草药的群众运动，又发掘和创造出大量具有战备意义和防治常见病，多发病的单方、验方，用现代科学对祖国医药学进行研究，加以提高的工作，也取得了丰硕成果。

无数事实证明：以毛泽东思想为指导，把在不同历史条件下发展起来的中医和西医、中药和西药结合起来，是发展我国医药科学唯一正确的道路。中医医药学和西医医药学都是劳动人民智慧的结晶，虽各自成系统，但各有所长，也各有所短，两者都不能偏废，都不能取而代之。只有按照毛主席“古为今用，洋为中用”、“推陈出新”的方针，在防治疾病的实践中把两者结合起来，形成我国统一的新医学、新药学，才是历史发展的必然。也只有这样，才能更好地保障劳动人民的健康，符合我国社会主义革命和社会主义建设对医药学的要求。

二、药物作用的基本规律

所谓药物作用是指药物对人体和病原体的影响。另一方面，进入体内的药物也受机体的作用而发生变化。因此，药物作用实际上是药物与机体的相互作用。

（一）治疗作用与不良反应

事物都是一分为二的，药物的作用也如此，绝对无毒的药物是没有的。通常，根据用药的目的，把药物的作用区分为治疗作用和不良反应两大类。

所谓治疗作用是指用药后出现的与治疗目的一致作用，可以概括为三种形式：

1. **调节功能：**祖国医学认为，阴阳失调乃是疾病发生的本质，药物治病正是“利用药性之偏，调整人体阴阳之偏，”达到平衡之目的，现代科学也认为，机体的某种机能过高或过低，均可致病，此时，用药的目的就在于通过其兴奋或抑制作用来调节功能，使之恢复正常。例如呼吸衰竭时，呼吸中枢处于抑制过程占优势状态，可以采用适量中枢兴奋药治疗；而惊厥时，中枢神经系统处于过度兴奋状态，则采用适当的中枢抑制药对抗之。。

2. **对抗感染：**对于病原微生物或寄生虫所致的疾病，应用抗感染药物，能够帮助机体杀灭或抑制这些病原体，起病因性治疗作用，如抗菌素和驱虫药等。

3. **补充缺乏的生理必需物质：**对于各种原因引起的生理物质或营养缺乏病（如口角炎、缺铁性贫血和糖尿病等），在对因治疗的同时，补充机体所缺乏的物质（维生素、铁和胰岛素等）是必要的。

不良反应是用药后出现的与防治目的无关，甚至有害于机体的作用，主要有下列四种形式：

1. **副作用：**是指在药物治疗剂量时，伴同治疗作用出现的与治疗目的无关作用。例如，用阿托品治疗胃肠绞痛时，它解除胃肠平滑肌痉挛的作用是治疗作用，而抑制腺体分泌，引起口干为副作用。但在全身麻醉，用于麻醉前给药时，抑制腺体分泌，避免支气管粘膜分泌过多是治疗作用，而松弛胃肠道平滑肌所引起的腹胀就成了副作用。

2. **毒性反应：**是指药物引起机体比较严重的机能紊乱，甚至造成组织病理改变的作用。这种不良反应多发生于药量过大或连续用药过久。例如阿托品过量中毒时可致中枢神经过度兴奋，产生幻觉、焦躁不安、谵妄、心律不齐，严重者可出现昏迷以至呼吸麻痹。所以严格掌握剂量是十分必要的，不要轻易超过药典规定的常用量，以免造成不良后果。

然而，问题不是绝对的，在特定条件下，为了抢救病人的需要，有时还可以在密切观察下，使用超过治疗量的剂量，例如应用阿托品抢救有机磷酸酯类农药重度中毒或感染中毒性休克时，每次剂量不是常用的0.3毫克，而是1～2毫克，甚至5～10毫克，超过常用量的几十倍，才能发挥充分疗效。

3. **变态反应**：是指有特殊体质的个体与某种药物（药物或其代谢物是一种半抗原，与体内的蛋白质结合形成全抗原）接触后产生的异常免疫反应，例如青霉素引起的过敏性休克，磺胺类引起的剥脱性皮炎和胙苯哒嗪引起的红斑性狼疮等。变态反应与付作用、毒性反应不同，它与剂量关系不大，而与体质关系密切，对于这种个体，很小剂量即可发生反应。

4. **继发反应**：是继发于药物的治疗作用而出现的不良反应。例如长期大剂量应用广谱抗菌素，可使敏感的病原菌和正常寄殖于肠道的细菌同时受到抑制，而不敏感菌或耐药菌得以大量繁殖，造成新感染，即二重感染。

（二）影响药物作用的因素

药物的作用是药物与机体相互作用的综合表现，药物方面和机体方面的多种因素均可对之发生影响。因此，在选用药物时必须掌握其规律性，注意分析病人的具体情况，充分调动病人的积极性。

机 体 方 面

“外因是变化的条件，内因是变化的根据，外因通过内因而起作用。”药物是战胜疾病的外因之一，它只能对机体固有的功能加以调节，并不能使机体产生新的功能。同时，机体方面的许多因素对药物的作用有着重要的影响。

1. **病人的精神状态**：在同疾病作斗争中，病人的精神状态对疾病的过程和药物的作用常常起着重要的影响，因此，必须注意用马列主义，毛泽东思想调动病人的主观能动性，肃清“唯药物论”在医学领域中的流毒，树立革命乐观主义精神和对疾病作斗争的坚强意志，促进疾病向痊愈方向发展。

2. **年龄和性别**：通常所指的剂量，是指成人即18~60岁患者的一次平均用量，幼年或60岁以上老人，除体重不同外，更重要的是由于生理和新陈代谢上有其特殊性，即使按体重计算，对某些药物的反应性仍与成年人有一定的差别。例如小儿对吗啡特别敏感，容易出现呼吸抑制，但对催眠药、磺胺类、抗菌素、阿托品及强心甙等，则比成人有较大的耐受性。

在性别方面，特别是对于妊娠、产后、授乳期妇女，用药时均应注意其生理特点。例如妊娠期不宜应用强烈泻药（硫酸镁等），以免引起流产。临产期及授乳妇女应用吗啡，可能引起新生儿及婴儿呼吸抑制，均应避免。至于性激素对不同性别的影响，更是不言而喻。

3. **个体差异**：不同个体，即使性别、年龄、体重及病情相同，对药物的反应性也有差别，称为个体差异。

（1）量的差异——高敏性和耐受性

有的个体对某种药物特别敏感，应用很小剂量即能产生比一般人强得多的药理作用，甚至出现毒性反应，称为高敏性。相反，有的个体对某种药物的敏感性很低，需用比一般人大得多的剂量，甚至中毒量才有效，称为耐受性。个别药物如吗啡具有成瘾性，久用成瘾后，突然停药可发生严重的症状，称为戒断症状。

病原体对某些化疗药物反复应用后所表现的耐受性，称为抗药性或耐药性。

(2) 质的差异——特异质

极少数个体对某些药物的反应性与一般人有本质不同，对一般人，即使应用中毒量也不会发生这种反应。这种特殊体质称为特异质。

其中有一些特异质反应如青霉素所致的过敏性休克，是一种变态反应。但是，也有一些特异质反应可能由遗传因素决定，如伯氨喹啉引起的急性溶血性贫血，多见于红细胞缺乏6-磷酸葡萄糖脱氢酶的病人。

4. 病理因素：病理状态对药物作用有很大的影响。例如解热镇痛药只有发热的病人应用，才能产生退热作用，并不影响正常体温。化脓性脑膜炎时，血脑屏障通透性增加，青霉素加大剂量肌肉注射，可以使脑脊液达到有效浓度，不必鞘内注射。

药 物 方 面

1. 不同的药物：临床应用的绝大多数药物，主要是对机体（或病原体）某特定器官或组织细胞发生较明显作用，而对其他器官或组织细胞则很少影响，甚至几乎不发生作用，即所谓选择性作用。例如洋地黄，对心肌具有高度选择性兴奋作用，对其他器官影响极少。化学结构相似的药物，大多数作用也相似（例如磺胺醋酰与磺胺），但是，有些药物虽然结构相似（例如对氨基苯甲酸与磺胺或磺胺醋酰），作用可以相反，对氨基苯甲酸是某些细菌的生长物质，而磺胺或磺胺醋酰由于化学结构与之相似，能与对氨基苯甲酸发生竞争性抑制，表现其抗菌作用。

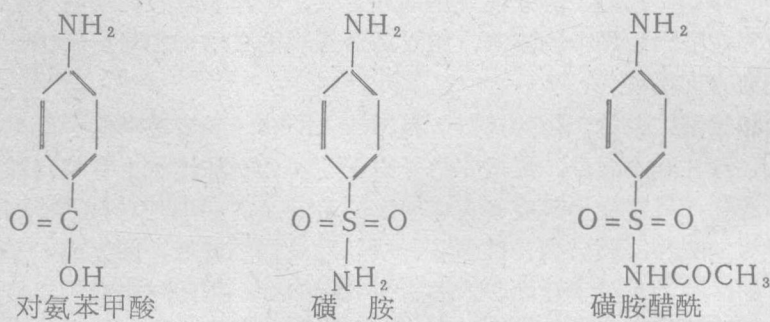


图 1—1 对氨基苯甲酸，磺胺和磺胺醋酰的结构关系

2. 同种药物：

(1) 剂量：剂量是决定机体对同一药物反应强度的主要因素。剂量不同，药物的作用不仅可以发生量变，而且可以发生质变。所谓“治疗量”是指对大多数人能起治疗作用的安全剂量；而“极量”是治疗量的极限。超过极量，就容易发生中毒，称为“中毒量”。药物的安全度取决于最小治疗量与最小中毒量之间的距离，距离宽者，安全度就大，反之亦然。对于安全度小的药物如强心甙、中枢兴奋药等，应用时要特别细心。

老 幼 剂 量 折 算 表

年 龄	剂 量
60岁以上	3/4 成人剂量
14~18岁	3/4 成人剂量
11~14岁	1/2~2/3 成人剂量
7~11岁	1/3~1/2 成人剂量
4~7岁	1/4~1/3 成人剂量
2~4岁	1/6~1/4 成人剂量
1~2岁	1/8~1/6 成人剂量
6个月~1岁	1/12~1/8 成人剂量
1~6个月	1/24~1/12 成人剂量
初生~1个月	1/24 成人剂量

注：本表仅供参考，使用时可酌情（发育、营养、体重或其他原因）决定剂量。

按体重儿童剂量算法：先由年龄推算体重，再计算剂量。

1~6个月：体重（公斤）= 月龄 $\times$ 0.6 + 3

7~12个月：体重（公斤）= 月龄 $\times$ 0.5 + 3

1岁以上：体重（公斤）= 年龄 $\times$ 2 + 7

小儿剂量 = 成人剂量 $\times \frac{\text{小儿体重（公斤）}}{50 \text{（成人平均体重）}}$

（2）给药途径：同种药物给药途径不同，由于影响吸收的速度和吸收量，对药物的作用也有重要影响。按照吸收速率由快到慢，次序如下：静脉注射 $>$ 吸入法 $>$ 肌肉注射 $>$ 皮下注射 $>$ 舌下给药 $>$ 直肠内给药 $>$ 口服。

3. 配伍作用：两种或两种以上的药物一起使用，称为配伍。配伍作用有三种表现形式，即相加、增强和相减。前二者又称协同作用，后者称为拮抗作用。配伍用药的目的是利用协同作用提高疗效，减轻毒性作用，利用拮抗作用以减少不良反应，及抢救中毒。

药 物 的 体 内 经 历

药物进入机体后，一般都要经历吸收、分布、代谢和排泄的过程。这些经历直接影响药物在组织中的浓度，与药物作用的强弱、快慢及持续时间密切相关。

1. 吸收及分布：从给药开始到药物进入血液循环的过程，称为吸收。吸收是药物发挥全身作用的前提。给药方法不同对吸收速率的影响已如前述，此外，还有许多因素也能影响药物的吸收和分布。

吸收环境中如有大分子化合物存在，可以妨碍吸收。口服药物如果在饭前给药，吸收较完全。但是刺激性较强的药物如阿斯匹林，应嘱饭后服药。对于在酸性环境中会失效的药

物，可制成抗酸的肠溶片或胶囊，如红霉素，服时勿咬碎。

不溶解的药物就不能吸收。一般，水溶性小分子药物较易吸收。许多药物在胃肠道的吸收主要取决于脂溶性和解离度，脂溶性高解离度低的药物容易吸收，也容易通过血脑屏障，因此，脑脊液浓度较高。季铵盐药物，水溶性高，但主要以离子态存在，口服难以吸收，注射给药后脑脊液浓度很低。

药物的分布与作用有一定关系，氯喹在肝较集中，而很少分布到肠，故治疗肝阿米巴病疗效高，而对肠阿米巴病无效。磺胺嘧啶在脑脊液中的浓度高于磺胺噻唑，所以在治疗流行性脑膜炎时，多用磺胺嘧啶。另外，药物分布比较集中的器官，往往易于造成毒性损害，如链霉素分布在耳内淋巴的浓度相当于血浓度的670倍，可以引起严重的前庭功能紊乱和听觉障碍。不过，应该指出：并不是所有药物的分布与其作用部位之间都存在直接联系的，分布多的组织往往不是表现药理作用的器官。例如，洋地黄多集中于肝脏，心肌含量极少，但其药理作用却主要表现在心脏，对肝脏则几无影响。

2. 代谢：进入体内的药物，在发挥作用的同时，大多也被机体通过代谢而失效，只有少数药物经代谢后才能发挥作用，例如非那西汀，须经体内转化为对乙酰氨基酚才有解热作用。代谢的主要方式有氧化、还原、分解及结合等。这些变化主要在肝脏进行，因此，肝功能障碍时，经肝代谢的药物解毒减少，毒性加大，应酌情减量或慎用。

3. 排泄：一切药物无论在体内是否经过变化，最后都要从机体排出。药物排泄的速度是决定药物在体内存留时间长短的重要因素。排泄快者，存留时间就短，为了维持疗效，必须反复多次给药。反之，解毒和排泄缓慢的药物，在体内存留时间较长，疗效持久，用药的间歇时间应该相应延长。例如磺胺类药物，磺胺异恶唑排泄快，半寿期（进入体内的药物分子数消除一半所需的时间）仅6小时，故一日需服药4次，而磺胺—5.6—二甲氧嘧啶排泄很慢，半寿期长达150小时，故一周只需服药1次，又称为周效磺胺。

许多药物主要经肾排泄，因此，肾功能障碍势必影响这些药物及其代谢产物从机体排出，如果不加分析地常规给药，极易造成蓄积性中毒。为此，对于这部份药物（链霉素类等），在肾功能轻度障碍时，应该适当减量或延长给药的间歇时间，在肾功能重度损害时，则应改用他药代替。

第二章 鎮靜催眠药

概 說

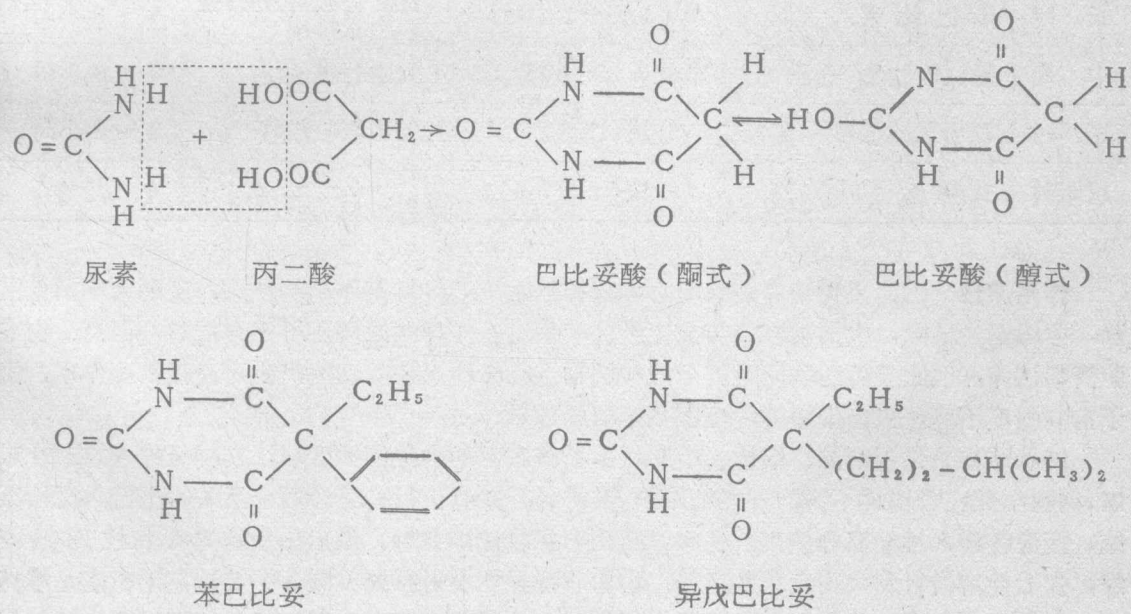
镇靜催眠药是一类对中枢神经系统产生抑制作用的药物，它们的抑制程度随剂量的大小而不同。小剂量轻度抑制中枢神经系统，产生镇靜作用，此时意识尚存在，行动自如。中等剂量抑制加强，产生类似生理睡眠的催眠作用，但强刺激仍可引起反应（故称镇靜催眠药）。大剂量则深度抑制，意识消失，出现全身麻醉作用，此时脊髓亦被抑制。此外还有抗惊厥作

用。更大剂量则抑制延髓生命中枢，可因呼吸麻痹与循环衰竭而死亡。然而，药物引起的睡眠与生理睡眠毕竟有所不同，特别表现在入睡与醒后两个阶段，少数人应用催眠药不产生睡眠而出现酒醉现象，如躯体有剧烈疼痛者尚可出现兴奋躁动的症状。药物催眠醒后常有后遗症，即醒后几小时内精神萎靡不振，判断力亦受一定影响，称为宿醉。长时作用的催眠药宿醉较为明显。此外还有一些其他不良反应（见后）。所以要有一分为二的观点，在实践中注意其不利的一面，不能滥用。

第一节 巴 比 妥 类

巴比妥类催眠药种类较多，目前常用的为：苯巴比妥（鲁米那）、异戊巴比妥（阿米妥）、司可巴比妥（速可眠）、硫喷妥钠。

化学结构和作用的关系 巴比妥类的基本结构相似，均为巴比妥酸的衍生物，巴比妥酸系由尿素与丙二酸缩合而成。巴比妥酸本身无催眠作用，须于第5位碳上的氢被不同基团取代，才得到具有催眠作用的不同巴比妥类药物。当其取代基团为短链烃基或苯环时，则作用出现慢，持续时间长，如苯巴比妥。取代基团为较长链的烃基或烃基有分枝与不饱和者则作用出现快，持续时间短，如异戊巴比妥与司可巴比妥。如于第2位碳上的氧被硫取代则作用出现更快，维持时间更短，如硫喷妥钠。因此巴比妥类药物依其显效的快慢，维持时间的长短，可分为长、中、短、超短四种类型。硫喷妥钠由于作用特快，维持时间极短，不适于镇静催眠应用，只作静脉麻醉用。



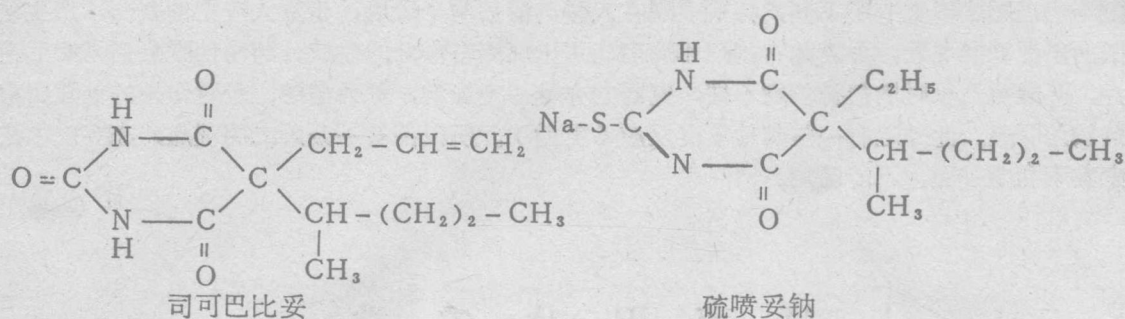


图 2—1 巴比妥类化学结构

体内过程 巴比妥类易从胃肠道吸收，其钠盐作肌内注射吸收更快。吸收入血后，迅速分布于全身一切组织和体液中，它们进入脑组织的快慢取决于药物的脂溶性的高低，脂溶性高者易透过血脑屏障，进入脑组织快，故作用出现快，如司可巴比妥。脂溶性低者进入脑组织慢，故作用出现较慢，如苯巴比妥。异戊巴比妥则介于两者之间。

巴比妥类在体内的消除方式：经肝脏破坏与原形不变由尿排出两种。异戊巴比妥与司可巴比妥大部份经肝脏氧化失效。苯巴比妥部份（73%）在肝脏破坏，部份（27%）为原形由尿排出。硫喷妥钠则先贮存于脂肪与肌肉组织，然后由肝脏氧化失效。

表 2—1 常用巴比妥类药物的作用比较

分 类	常用 药 物	脂溶性	显 效 时 间	消 除 方 式	维持时间
长 时	苯巴比妥	低	慢（1/2~1 小时）	部份肝脏破坏部份原形由尿排出	6~8 小时
中 时	异戊巴比妥	稍高	略快（15~30 分）	主要由肝脏破坏	3~6 小时
短 时	司可巴比妥	高	快（15 分）	主要由肝脏破坏	2~3 小时
超短时	硫喷妥钠	高	快（1 分）	先贮存于脂肪与肌肉组织，后在肝内破坏	30 分钟

作用原理 巴比妥类镇静催眠药对中枢神经系统产生抑制作用的特点，表现为小剂量镇静，中等剂量催眠，大剂量麻醉与抗惊厥。产生这些作用的原理还不完全清楚，根据动物实验资料认为：巴比妥类药物能对脑干网状结构上行激活系统的功能产生可逆性抑制作用，由于抑制强度不同，遂出现镇静，催眠和麻醉的效果。

网状结构是位于延脑、脑桥、中脑直至丘脑底部的中央广大区域，其神经纤维交错成网，网眼中散在着境界不明的神经细胞群，其神经径路有上行和下行两个系统。上行为激活系统，接受各传入神经束的侧支，在网状结构内经过许多突触，最后由丘脑的网状核发出纤维，弥散性地投射到大脑皮层各区域，称为非特异性投射系统（图 2—2）。它的机能是维持大脑皮层处于醒觉状态。上行激活系统的机能若被药物抑制则出现镇静、催眠或麻醉等效果