

21世纪应用型人才护理系列规划教材  
供高职高专(应用型本科)护理专业及相关医学专业使用

# 药 理 学

主 编 胡 敏

副主编 梁生林 廖海涛

编 者 (按姓氏笔画排序)

万云辉(江西护理职业技术学院)

刘昌发(郑州铁路职业技术学院)

金志华(金华职业技术学院)

胡 敏(江西护理职业技术学院)

梁生林(井冈山学院医学院)

廖海涛(广西医科大学护理学院)

同济大学出版社

## 内 容 提 要

药理学是护理、助产、口腔、药剂等专业的必修课,是基础医学与临床医学之间的桥梁学科。根据高职高专人才培养工作的基本思路,优化和重组教学内容,以应用为主旨和特征,理论知识以“必须、够用”为度,注重“基础性”与“应用性”。本教材在研究各个版本药理学教材及查阅有关药理学文献的基础上编写而成。注重理论与实践的结合与渗透,突出护理专业的特点,重点明确、难点详述、学说简化,从而在教学上有利于发挥学生的主体作用,有利于培养学生学会学习,有利于培养学生的创新精神,有利于学生个性和潜能的发展。

本教材适合于高职高专及应用型本科护理专业和相关医学专业使用。

### 图书在版编目(CIP)数据

药理学/胡敏主编.—上海:同济大学出版社,2007.7

(21世纪应用型人才护理系列规划教材)

ISBN 978-7-5608-3599-0

I.药… II.胡… III.药理学—高等学校:技术学校—教材 IV.R96

中国版本图书馆CIP数据核字(2007)第101611号

---

---

21世纪应用型人才护理系列规划教材

## 药 理 学

主 编 胡 敏

责任编辑 沈志宏 责任校对 杨江淮 装帧设计 陈益平

---

出版发行 同济大学出版社 [www.tongjipress.com.cn](http://www.tongjipress.com.cn)  
(地址:上海市四平路1239号 邮编:200092 电话:021-65985622)

经 销 全国各地新华书店

印 刷 同济大学印刷厂

开 本 787mm×1092mm 1/16

印 张 21.75

印 数 1—5100

字 数 543000

版 次 2007年9月第1版 2007年9月第1次印刷

书 号 ISBN 978-7-5608-3599-0/R·186

定 价 35.00元

---

---

本书若有印装质量问题,请向本社发行部调换 版权所有 侵权必究

## 编审委员会名单

- 主 任** 云 琳
- 副 主 任** 胡 野 吴国平 张龙禄
- 常务委员** 云 琳 胡 野 吴国平 张龙禄  
许福生 吴之明 赵凤臣
- 编 委** (按姓氏笔画为序)
- 云 琳 (河南职工医学院)
- 王兴华 (滨州医学院护理系)
- 许福生 (同济大学高等技术学院)
- 朱卫民 (广西医科大学护理学院)
- 李爱玉 (井冈山学院护理学院)
- 吴之明 (大连大学医学院)
- 吴国平 (江西护理职业技术学院)
- 吴文源 (同济大学附属同济医院)
- 张龙禄 (宁波天一职业技术学院)
- 胡 野 (金华职业技术学院)
- 赵凤臣 (郑州铁路职业技术学院)
- 赵旭东 (同济大学医学院)
- 唐萍芬 (昆明医学院护理学院)
- 顾正义 (六盘水职业技术学院)
- 戴鸿英 (上海交通大学护理学院)
- 学术顾问** 姜安丽 (第二军医大学)
- 学术秘书** 赵凤臣 (郑州铁路职业技术学院)

## 总 序

根据教育部《关于加强高职高专教育教材建设的若干意见》的精神,由同济大学出版社组织郑州铁路职业技术学院和同济大学高等技术学院等十余所院校,联合编写了“21世纪应用型人才护理系列规划教材”,适合于高职高专(应用型本科)护理及相关专业使用。

本套教材编写的指导思想是坚持以就业为导向,以能力为本位,紧密围绕培养高等技术应用性护理专门人才的目标,根据整体性、综合性原则,按照护理专业的特点将原有的课程进行有机重组,使之融合成为新的与护理专业相适应的课程体系,编写出具有21世纪职业技术人才培养特色的教材。

教材内容的安排,坚持以“必需、够用”为度,着力体现教材的思想性、科学性、先进性、启发性和适用性等原则;坚持以培养技术应用能力为主线设计教材的结构和内容。在医学基础课程的设置中,淡化传统的学科意识,以多学科的综合为主,强调整体性和综合性,对不同学科的内容进行了有机融合与精简。专业课程的设置以培养解决临床问题的技能为重心的,教学内容上体现先进性和前瞻性,充分反映护理领域的新知识、新技术、新方法。整个课程体系有利于学生学习和发展,既适应我国的实际需要,又逐步与国际护理教育接轨。

基于此,2006年6月,同济大学出版社在郑州铁路职业技术学院召开高职高专护理专业系列教材研讨会。参加会议的代表来自同济大学高等技术学院、金华职业技术学院和江西护理职业技术学院等11所高等院校。会议成立了本系列护理专业教材编审委员会,确定了教材编写体系,审定了编写大纲,在各所院校的大力支持下,相继召开了教材编写会议、审稿会议和定稿会议。

本系列教材包括《人体结构与功能》、《医用化学》、《生物化学》、《病原生物与免疫》、《药理学》、《病理学》等六门医学基础课程和《护理学基础》、《健康评估》、《内科护理学》、《外科护理学》、《儿科护理学》、《妇产科护理学》、《五官科护理学》、《临床护理操作技术规程》、《社区护理》、《急重症监护》、《临床营养学》、《医学心理学》、《老年护理学》、《康复护理学》、《护理管理学》、《护理行为学》等十六门专业课程。教材可供高职护理专业学生使用,其中的医学基础课教材也可供其他相关医学专业学生配套使用。为了方便教学,本系列教材将继续开发有关教学大纲、电子教材、电子教案、试题库以及实验指导等配套教学教辅光盘资料发行。

本系列教材的编写得到所有参编院校领导的大力支持,编审委员会从各院校推荐的众多

教师中认真遴选出部分学术造诣较深、教学经验丰富的教师担任主编和编委。各位编写人员克服了困难,按时圆满完成任务。在此谨向参编单位的领导和同仁表示由衷的感谢。

本系列教材的出版尽管尽了最大努力,但是由于时间仓促,水平和能力有限,不足之处在所难免,敬请有关专家和广大读者批评指正,今后将根据师生和读者意见不断修订完善。

云 琳

2007年5月

## 前 言

本教材是根据普遍高等教育“十一五”国家级规划教材的要求,为适应高职高专护理专业人才培养目标而进行编写的。编写时以“贴近学生、贴近岗位、贴近社会”为原则,简化理论叙述,以“必须、够用”为度,注重实际应用,强化专业培养目标,充分体现新编教材的实用性、可读性、科学性、启发性和创新性。

我们在编写过程中,坚持以药物的基本理论、基本知识和基本技能为主体,重点介绍药物的药理作用、临床应用、不良反应及用药注意事项,对药物的结构、体内过程、作用机制,除部分代表性药物外,不单独介绍。收编了较成熟的新理论和新药物,增加了实验教程内容,提高了实用操作的指导性。

本书在编写过程中,得到各编者单位的大力支持,在此表示衷心的感谢!由于编者水平有限,时间仓促,书中难免有错误和不足,恳请广大师生批评指正。

主 编

2007年5月

## 目 录

总 序 .....	1
前 言 .....	1
<b>第一章 药理学总论 .....</b>	<b>1</b>
第一节 概述 .....	1
第二节 药物效应动力学 .....	3
第三节 药物代谢动力学 .....	12
第四节 影响药物作用的因素及合理用药原则 .....	23
<b>第二章 传出神经系统药物 .....</b>	<b>31</b>
第一节 概述 .....	31
第二节 胆碱受体激动药与胆碱酯酶抑制药 .....	37
第三节 胆碱受体阻断药与胆碱酯酶复活药 .....	42
第四节 肾上腺素受体激动药 .....	48
第五节 肾上腺素受体阻断药 .....	57
<b>第三章 中枢神经系统药物 .....</b>	<b>61</b>
第一节 镇静催眠药及抗惊厥药 .....	61
第二节 抗癫痫药 .....	65
第三节 抗精神失常药 .....	69
第四节 抗帕金森病药 .....	75
第五节 镇痛药 .....	78
第六节 解热镇痛抗炎药 .....	82
[附]抗痛风药 .....	87

第七节 中枢兴奋药 .....	88
<b>第四章 麻醉药</b> .....	91
第一节 全身麻醉药 .....	91
第二节 局部麻醉药 .....	93
<b>第五章 心血管系统药物</b> .....	97
第一节 抗高血压药 .....	97
第二节 抗心绞痛药 .....	110
第三节 抗心律失常药 .....	114
第四节 抗慢性心功能不全药 .....	123
第五节 调血脂药 .....	131
<b>第六章 血液和造血系统药</b> .....	139
第一节 抗贫血药 .....	139
第二节 影响血凝过程的药物 .....	142
第三节 促白细胞增生药 .....	149
第四节 血容量扩充药 .....	151
<b>第七章 作用于呼吸系统药</b> .....	153
第一节 平喘药 .....	153
第二节 镇咳药 .....	158
第三节 祛痰药 .....	160
<b>第八章 作用于消化系统药</b> .....	163
第一节 助消化药 .....	163
第二节 抗消化性溃疡药 .....	164
第三节 泻药和止泻药 .....	170
第四节 止吐药 .....	173

第九章 利尿药和脱水药 .....	176
第一节 利尿药 .....	176
第二节 脱水药 .....	183
第十章 组胺和抗组胺药 .....	186
第一节 组胺 .....	186
第二节 组胺受体阻断药 .....	186
第十一章 作用于子宫的药物 .....	190
第一节 子宫收缩药 .....	190
第二节 子宫舒张药 .....	192
第十二章 激素及有关药物 .....	194
第一节 肾上腺皮质激素类药 .....	194
第二节 甲状腺激素和抗甲状腺药 .....	200
第三节 胰岛素及口服降血糖药 .....	206
第四节 性激素类药与避孕药 .....	210
第十三章 抗微生物药 .....	217
第一节 概述 .....	217
第二节 $\beta$ -内酰胺类抗生素 .....	218
第三节 大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素 .....	224
第四节 氨基苷类抗生素 .....	228
第五节 四环素类和氯霉素 .....	231
第六节 人工合成抗菌药 .....	234
第七节 抗结核病药 .....	240
第八节 抗真菌药和抗病毒药 .....	242
第九节 消毒防腐药 .....	247

<b>第十四章 抗寄生虫病药</b> .....	255
第一节 抗疟药 .....	255
第二节 抗阿米巴病药 .....	259
第三节 抗滴虫病药 .....	262
第四节 抗血吸虫病药 .....	262
第五节 抗丝虫病药 .....	263
第六节 抗肠蠕虫病药 .....	263
<b>第十五章 抗恶性肿瘤药</b> .....	267
第一节 概述 .....	267
第二节 常用的抗肿瘤药物 .....	269
第三节 应用和联合应用抗肿瘤药物的基本原则 .....	279
<b>第十六章 维生素类药</b> .....	283
第一节 水溶性维生素 .....	283
第二节 脂溶性维生素 .....	286
<b>第十七章 免疫功能调节药</b> .....	291
第一节 免疫抑制药 .....	291
第二节 免疫增强药 .....	294
<b>实验教程</b> .....	299
<b>第一部分 药物一般知识</b> .....	299
一、药典 .....	299
二、药品管理法 .....	299
三、药品分类与管理 .....	299
四、特殊管理药品 .....	300

五、药物制剂 .....	301
六、药物制剂的批号、有效期和失效期 .....	303
七、药物制剂质量的外观检查 .....	303
八、处方 .....	304
<b>第二部分 动物实验</b> .....	<b>306</b>
实验 1 不同剂量对药物作用的影响 .....	306
实验 2 不同给药途径对药物作用的影响 .....	307
实验 3 传出神经药对兔瞳孔的影响 .....	308
实验 4 去甲肾上腺素的缩血管作用 .....	309
实验 5 传出神经药对血压的影响 .....	310
实验 6 地西泮的抗惊厥作用 .....	312
实验 7 氯丙嗪的镇静和降温作用 .....	312
实验 8 镇痛药的镇痛作用 .....	313
实验 9 尼可刹米对呼吸抑制的解救 .....	314
实验 10 局部麻醉药对兔角膜的麻醉作用 .....	315
实验 11 普萘洛尔的抗缺氧作用 .....	315
实验 12 硝酸甘油的扩血管作用 .....	316
实验 13 强心苷对离体蛙心的作用 .....	317
实验 14 硫酸镁过量中毒的解救 .....	318
实验 15 呋塞米的利尿作用 .....	319
实验 16 糖皮质激素的抗炎作用 .....	320
实验 17 硫酸链霉素的急性中毒及其解救 .....	321
<b>中英文名词对照</b> .....	<b>323</b>
<b>参考文献</b> .....	<b>331</b>

## 第一章 药理学总论

### 学习要求

掌握药物的基本作用、药物作用的方式及概念、药物作用的两重性、药物-受体作用机制、量-效关系;熟悉药物、药理学、药效学、药动学、耐受性、精神依赖性、身体依赖性、耐药性、药酶、药酶诱导剂与抑制剂、生物利用度、半衰期的概念;药物的体内过程、表观分布容积、消除的动态规律、稳态血药浓度、影响药物作用的因素;了解药理学的发展简史、药理学在医学科学中的地位、学习药理学的方法;熟悉药物作用机制、药物的跨膜转运的类型及特点、药-时曲线、房室概念与房室模型、曲线下面积、消除速率常数、清除率。

### 第一节 概 述

#### 一、药理学的性质与地位

药物(drug)是用于预防、治疗、诊断疾病以及计划生育的化学物质。根据来源不同可分三类:①天然药物。从植物、动物或矿物质中分离、提取的活性物质或由生物技术制备,如抗疟药青蒿素、抗生素青霉素 G。②合成药物。人工合成的自然界存在或不存在的化学物质,如抗菌药物磺胺类。③基因工程药物。利用 DNA 重组技术生产的蛋白质,如纤维蛋白溶解药重组组织型纤溶酶原激活剂。药物的活性主要表现为增强或减弱机体某些器官的生理功能和(或)细胞代谢活动。

药理学(pharmacology)是研究药物与机体(包括病原体)相互作用的规律及其机制的学科。其研究内容包括药物效应动力学(pharmacodynamics,简称药效学)和药物代谢动力学(pharmacokinetics,简称药动学)两方面。前者研究药物对机体的作用,包括药物的药理作用、作用机制等;后者研究机体对药物的影响,包括药物在体内的吸收、分布、生物转化和排泄过程,以及血药浓度随时间而变化的规律等。药理学科的主要研究任务是在药效学和药动学研究基础上,指导临床合理用药防治疾病,研究开发新药,发现老药新用途,并为其他学科的发展提供实验资料。

药理学作为药物治疗学的理论基础,既与生理学、生物化学和病理学等基础医学有广泛联系,还与内科学、外科学及精神病学等临床医学密切相关。因此,药理学是基础医学与临床医学相互联系的桥梁学科。

## 二、药理学发展简史

**1. 本草学的发展** 古代人治病采用天然的植物、动物和矿物质产品。早在公元1世纪前后,我国就出现了最早的有关药物学的书《神农本草经》,全书收录了365种药物,其中不少药物沿用至今。唐代的《新修本草》(公元659年)是我国第一部,也是世界上第一部药典,收录药物884种。明代伟大医药学家李时珍耗尽毕生精力,亲身实践,去伪存真,写成《本草纲目》(1596年)这一传统医药的经典著作,全书共52卷,约190万字,收录药物1892种,插图1160幅,药方11000余条,该书不仅是国内研究中药者的经典书籍,而且受到国际医药界的关注,并先后译成英、日、朝、德、法、俄及拉丁等7种文本,流传于全世界,对促进我国和世界本草学的发展起了极其重要的作用。

**2. 现代药理学的发展** 19世纪初,随着化学(尤其是有机化学)和实验生理学的发展,开始在动物中观察药物效应和分析药物作用部位,创立了实验药理学。如1804年德国人F.W. Sertürner首先从罂粟中分离吗啡,并在犬身上证明有镇痛作用。1819年,法国人F. Magendie用青蛙实验确定土的宁的作用部位是在中枢神经系统的脊髓部位。这些工作为后来研究药物作用部位的器官药理学打下了基础。1878年,英国人J.N. Langley根据阿托品与毛果芸香碱对猫唾液分泌的不同作用研究,提出了受体(receptor)的概念。1909年,德国人P. Ehrlich用脾凡纳明治疗梅毒和锥虫病,并创立了化学药物治疗传染病的新纪元。接着1935年德国人Domagk发现磺胺药可治疗细菌感染。1940年,英国人H.W. Florey在A. Fleming(1928)研究的基础上从青霉菌培养液中分离出青霉素。从此,使化学治疗进入抗生素时代。

近年来,随着其他学科的发展,尤其是分子生物学技术的应用和发展促进了药理学的迅速发展,药理学已产生了许多各具特色的分支学科,如心血管药理学、神经药理学、生殖药理学、内分泌药理学、免疫药理学、肿瘤药理学、中药药理学、生化药理学、分子药理学、临床药理学、遗传药理学、老年药理学、围生期药理学、时间药理学等。对药物作用机制的研究也逐步深入,由原来的系统、器官水平深入到细胞、亚细胞及分子水平。

我国药理学开始于20世纪20年代,当时各医学院校相继开设了实验药理学课程,对培养我国的药理学专业人才起了重要作用。50年代我国开始对治疗血吸虫病的酒石酸锑钾和呋喃丙胺进行了研究。60年代初我国学者确认吗啡的镇痛作用部位主要在丘脑第三脑室周围灰质。在中草药研究方面,我国相继开发了不少有效药物,尤其是抗疟药青蒿素的研制成功,受

到全世界关注。此外,在我国传统中医理论指导下,采用中西医结合方式,在复方药物的研制方面也取得了举世瞩目的成果。

### 三、学习药理学的方法

**联系基础医学理论** 由于药物不会产生与机体原有功能无关的新作用,因此有针对性地联系相关的基础医学知识,对掌握药理作用与作用机制,有事半功倍的效果。

**掌握药物的特点** 理解药物分类与代表药物,有助于掌握每类药物作用的共同规律;比较同类药物在药效学、药动学及临床用途等方面的个性特点,有助于正确选用药物。

**注意药物的两重性** 小剂量的毒物可能是很好的药物,而有效的药物用量过大也就成了毒物。因此,必须全面掌握药物的治疗作用与不良反应,力求安全、有效地使用药物。

**重视药理学实验** 药理学属于实验科学。认真进行药理学实验,不仅有助于验证药理学理论,训练实验操作技能,而且有助于培养观察和分析事物的能力。

## 第二节 药物效应动力学

### 一、药物作用

药物作用(drug action)是指始发于药物与机体细胞之间的分子反应;药物效应(drug effect)是指继发于药物作用之后的机体功能形态的变化。两者之间有因果关系。由于药物与机体细胞之间的分子反应及功能形态变化有密切联系,所以两者常相互通用。

**1. 药物的基本作用** 药物的基本作用是指药物对机体原有功能活动的影响。尽管药物的种类繁多,但其作用都是在机体原有生理生化功能基础上产生的。凡使原有功能活动增强的作用称为兴奋作用(excitation action),如肌肉收缩、腺体分泌增多、酶活性增强等。凡使原有功能活动减弱的作用称为抑制作用(inhibition action),如肌肉松弛、腺体分泌减少、心率减慢等。机体功能活动的兴奋和抑制,在一定条件下可互相转化,如中枢神经系统过度兴奋可导致惊厥,长时间的惊厥可转化为衰竭性抑制,甚至死亡。

### 2. 药物作用的方式

**1) 直接作用和间接作用** 直接作用(direct action)是指药物与组织器官直接接触所产生的作用,也称原发作用(primary action),如胍屈嗪直接作用血管平滑肌,使之松弛产生降压作用。间接作用(indirect action)又称继发作用(secondary action)是指药物的某一作用引起的另一作用,大多通过神经反射或体液调节引起,如强心苷直接作用于心脏,加强心肌收缩力,改善

心力衰竭症状,而随之产生的利尿、水肿减轻即为继发作用。

2) 局部作用和吸收作用 局部作用(local action)是指药物吸收入血以前,在用药部位所呈现的作用。如碘酊用于皮肤的消毒作用;局麻药的局部麻醉作用;口服碳酸氢钠的中和胃酸作用等。药物从给药部位吸收入血后,随着血液循环分布到组织器官所发生的作用称为吸收作用(absorption action)。如舌下含服硝酸甘油的抗心绞痛作用;口服或肌内注射阿莫西林的抗感染作用。

3) 药物作用的选择性 药物在适当剂量时对机体不同组织器官在作用性质或作用强度方面的差异称为药物作用的选择性(selective action)。大多数药物在治疗剂量时只对某个组织器官有明显作用,而对其他组织器官无作用或无明显作用。如强心苷类,对心肌有很强的选择性,很小剂量就有正性肌力作用;而对骨骼肌和平滑肌,即使应用很大剂量也无作用。产生药物作用选择性的基础是:①药物分布不均匀;②药物与组织亲和力不同;③组织结构有差异;④细胞代谢有差异。

选择性作用在理论上可作为药物分类的基础,在应用上可作为临床选药的依据,在制药上可作为研究的方向。一般地说,选择性高的药物针对性强,不良反应少,但应用范围窄;而选择性低的药物针对性差,不良反应多,但应用范围广。

**3. 药物作用的两重性** 药物作用具有两重性,既可呈现对机体有利的治疗作用,又可产生对机体不利的不良反应。临床用药时,应充分发挥药物的治疗作用,尽量减少药物不良反应发生率。

1) 治疗作用(therapeutic action) 凡符合用药目的或能达到防治效果的作用称为治疗作用。根据治疗目的不同可将其分为以下几种。

(1) 对因治疗(etiological treatment) 用药目的在于消除原发致病因子,彻底治愈疾病,称为对因治疗,或称治本。如抗生素杀灭体内的病原微生物。

(2) 对症治疗(symptomatic treatment) 用药目的在于改善疾病的症状,称为对症治疗,或称治标。如高热时用解热镇痛抗炎药来退热。

通常,对因治疗比对症治疗重要,但在休克、惊厥、哮喘及心功能不全等危重急症时,对症治疗比对因治疗更为迫切和重要,故要急则治其标(对症),缓则治其本(对因),标本兼治。

(3) 补充治疗(supplementary therapy)或替代治疗(replacement therapy) 用药目的在于补充体内营养或代谢物质的不足。补充治疗不能去除原发病灶,也不直接针对症状,严格地说,与对因治疗和对症治疗均有区别。

2) 不良反应(adverse reaction) 凡不符合用药目的或给病人带来痛苦与危害的反应称为不良反应。按其性质不同可分为以下几类。

(1) 副作用(side reaction) 药物在治疗量时出现与用药目的无关的作用称为副作用。副作用一般都较轻微,是可逆性的功能变化。其产生原因是药物的选择性低,作用广泛,当其中一种作用作为治疗作用时,其他的作用就成为副作用。但副作用和治疗作用可随着用药目的不同而互相转化。如阿托品可抑制腺体分泌、解除平滑肌痉挛、加快心率等,若用于麻醉前给药时,其抑制腺体分泌作用为治疗作用,而松弛平滑肌引起的腹胀气和尿潴留成为副作用;若用于治疗胃肠绞痛时,其松弛平滑肌作用为治疗作用,而抑制腺体分泌引起的口干就成为副作用。

由于副作用是用治疗量时出现,通常是难以避免的,但有些药物的副作用可设法纠正。如用麻黄碱治疗支气管哮喘时有中枢兴奋作用,可引起病人失眠,若同时服用催眠药可予纠正。

(2) 毒性反应(toxic reaction) 用药剂量过大、用药时间过长或机体对药物敏感性过高时产生的危害性反应称为毒性反应。用药后立即发生者称为急性毒性(acute toxicity);长期体内蓄积而缓慢发生者称为慢性毒性(chronic toxicity)。毒性反应对病人的危害性较大,在性质和程度上也与副作用不同。毒性反应的表现主要是对中枢神经系统、消化系统、血液及循环系统,以及肝、肾功能等方面造成功能性或器质性损害,甚至危及生命。每个药物都可出现其特定的中毒症状。

通常,有些药物的毒性反应是可预期的。如损害肝、肾功能或造血系统的药物,应定时检查有关肝、肾和血液的生化指标。在临床用药时,应注意掌握用药的剂量和间隔时间,必要时应停药或改用其他药物。

(3) 变态反应(allergic reaction) 又称过敏反应,是指少数致敏的机体对某些药物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。致敏原可以是药物本身、药物的代谢物或药物制剂中的其他物质。致敏原刺激机体产生抗体,当药物再次进入机体后引起抗原抗体反应,临床常见的有药热、皮疹、哮喘等,严重时可引起过敏性休克。对于易致过敏的药物或过敏体质者,用药前应询问病人有无用药过敏史,并需做过敏试验,凡有过敏史或过敏试验阳性反应者,禁用有关药物。

(4) 特异质反应(idiosyncrasy) 少数特异体质病人对某些药物的反应特别敏感,反应严重程度与剂量有关。这种反应不是免疫反应,是由于先天遗传异常所致的反应,如葡萄糖-6-磷酸脱氢酶(G-6-PD)缺乏者,在应用伯氨喹等药物治疗时所发生的溶血现象。

(5) 后遗效应(residual effect) 停药后血药浓度已降至阈浓度(最小有效浓度)以下时残存的药理效应称后遗效应。如服用长效巴比妥类催眠药后,次晨仍有困倦、头晕、乏力等现象;长期应用糖皮质激素,导致停药后出现持久的肾上腺皮质功能低下。

(6) 继发反应(secondary reaction) 由于药物治疗作用引起的不良后果,称为继发反应,

又称治疗矛盾。如长期服用四环素类广谱抗生素引起的二重感染。

(7) 致突变(mutagenesis)、致畸(teratogenesis)及致癌(carcinogenesis) 致突变、致畸及致癌是药物损伤细胞遗传物质所致的特殊毒性作用,常用于评价药物的安全性。药物损伤DNA、干扰DNA复制所引起的基因变异或染色体畸变称为致突变;基因突变发生于胚胎生长细胞可致畸,发生于一般组织可致癌。药物通过妊娠母体进入胚胎干扰正常胚胎发育,导致胎儿发生永久性形态结构异常的作用称为致畸。如沙立度胺(thalidomide,反应停),孕妇用此药后常分娩畸形胎儿,致使四肢短小。妊娠第3周至第3月末是胎儿器官的分化形成期,有丝分裂活跃,最易受药物的影响,故在怀孕的头3个月内用药应特别谨慎。除非迫切需要,一般以不用药物为宜。药物造成DNA或染色体损伤,使抑癌基因失活或原癌基因激活,导致正常细胞转化为癌细胞的作用称为致癌。环磷酰胺、己烯雌酚等有致癌作用。

## 二、药物的作用机制

药物的作用机制(mechanism of drug action)是药效学研究的重要内容,主要研究药物在何处产生作用?如何产生作用?明确药物作用机制,有助于理解药物作用和不良反应的本质,从而为提高药物疗效和防止不良反应、合理用药、安全用药提供理论依据。

**1. 非特异性药物作用机制** 非特异性药物作用机制主要与药物的理化性质如解离度、溶解度、表面张力等有关,通过酸碱反应、渗透压改变、络合作用等而发挥疗效。如静脉注射甘露醇溶液,利用其高渗透压对周围组织产生的脱水作用,可消除脑水肿;此药在体内不被代谢,经肾排泄,故有渗透性利尿作用。口服硫酸镁后,由于 $Mg^{2+}$ 、 $SO_4^{2-}$ 不易被肠壁吸收,在肠内形成高渗盐溶液,可阻止肠道吸收水分,使肠内容积增大,刺激肠蠕动而导泻。口服氢氧化铝、三硅酸镁等抗酸药可中和胃酸,治疗消化性溃疡。口服碳酸氢钠可使尿液碱化,促进巴比妥类等酸性药物的排泄。依地酸钙钠在体内可与多数的二、三价金属离子络合,形成的络合物从尿中排出,可用于铅、镉、锰、铬、铜等金属中毒。

**2. 特异性药物的作用机制** 特异性药物的作用机制主要与药物的化学结构有关,它们通过改变酶、离子通道、受体等的功能,从而诱发一系列生理、生化效应。大多数药物属于此类药物,为结构特异性药物。

(1) 参与或干扰细胞代谢  $Fe^{2+}$ 参与血红蛋白的形成,可治疗缺铁性贫血;维生素D参与钙磷代谢,可治疗佝偻病。巯嘌呤可干扰嘌呤代谢而呈现抗癌作用。

(2) 影响酶的活性 卡托普利可抑制血管紧张素转化酶,减少血管紧张素II的形成,降低血压;奥美拉唑通过抑制胃黏膜壁细胞的 $H^+-K^+-ATP$ 酶,抑制胃酸分泌;氯解磷定能使受抑制的胆碱酯酶复活,用于治疗有机磷酸酯类中毒。