

药 理 学

(試用教材)

福建医科大学

一九七二年四月

毛主席語录

教育必須为无产階級政治服务，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，是这场无产階級文化大革命的一个极其重要的任务。

备战、备荒、为人民。

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庫，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。

14.42/854

目 录

第一章 总论	(1)
一、以毛泽东思想为指针, 为创造我国统一的新医学新药学而奋斗	(1)
二、药物作用的基本规律	(2)
(一) 药物的作用	(3)
(二) 药物在体内的过程 (体内经历)	(4)
吸收 分布 代谢 排泄	
(三) 影响药物作用的因素	(5)
药物方面的因素	(5)
1、药物的化学结构	(5)
2、药物的剂量	(5)
3、药物的配伍作用	(5)
机体因素对药物作用的影响	(6)
1、年龄、性别和体重	(6)
2、个体差异	(7)
3、病理因素	(7)
第二章 抗病原微生物药	(8)
一、磺胺类	(8)
二、呋喃衍生物	(12)
呋喃西林 呋喃妥因 呋喃唑酮	
三、抗菌素	(13)
青霉素 (新青霉素 I、II、III) 链霉素和双氢链霉素 四环素族 氯霉素和合霉素	
红霉素 新霉素 卡那霉素 庆大霉素 抗敌素和多粘菌素B 制霉菌素 灰黄霉素	
简介几种国内新抗菌素	
创新霉素 巴龙霉素 羧苄青霉素 强力霉素 杆菌肽 先锋霉素 I 号及先锋霉素 2 号 甲烯土霉素	
第三章 抗结核病药	(24)
异烟肼 (雷米封) 链霉素 对氨柳酸	
第四章 抗寄生虫病药	(26)
一、抗血吸虫病药	(26)
血防-846 酒石酸锑钾 (吐酒石) 呋喃丙胺 (F30066)	

二、抗丝虫病药.....	(30)
海群生(枸橼酸乙胺嗪)	
三、驱肠虫病药.....	(30)
枸橼酸哌嗪(驱蛔灵) 山道年 驱虫净 苯酚铵(灭虫宁) 四氯乙烯 槟榔和南瓜子	
四、抗疟药.....	(32)
(一) 主要控制症状的药物	
氯喹 奎宁	
(二) 控制复发及传播的药物	
伯氨喹啉	
(三) 预防用药	
乙氨嘧啶(息疟定)	
五、抗阿米巴病药.....	(35)
依米丁(吐根碱) 卡巴肿 喹碘方(药特灵 安痢生)	
六、抗滴虫病药.....	(36)
滴维净(乙酰胺肿) 灭滴灵(甲硝哒唑)	
第五章 作用于中枢神经系统的药物.....	(38)
一、催眠药.....	(38)
巴比妥类 水合氯醛 导眠能 安眠酮	
二、抗癫痫药.....	(41)
苯妥英钠 三甲双酮 扑痫酮(去氧苯比妥 密苏林)	
三、镇静药和安定药.....	(43)
(一) 溴化物.....	(43)
(二) 安定药.....	(43)
氯丙嗪 眠尔通 利眠宁 安他乐(羟嗪)	
四、镇痛药.....	(46)
吗啡 度冷丁(哌啶) 阿那度(安依痛)	
五、解热镇痛药和抗风湿药.....	(48)
非那西汀 阿司匹林(醋柳酸) 氨基比林 安乃近 保太松 抗炎松	
六、中枢兴奋药.....	(50)
咖啡因 可拉明(尼可刹米) 戊四氮	
印防已毒素 洛贝林(山梗菜硷)	
第六章 作用于传出神经末梢的药物.....	(53)
一、概说	
(二) 解剖生理	
(二) 传出神经药物的作用方式和分类.....	(55)
1、同受体结合的药物	
2、影响介质代谢的药物	

二、拟胆硷药.....	(56)
节后拟胆硷药.....	(56)
毛果芸香硷	
作用于胆硷脂酶的药物.....	(57)
毒扁豆硷 新斯的明 加兰他敏 有机磷酸酯类(农药) 胆硷酯酶复活剂	
三、抗胆硷药.....	(59)
节后抗胆硷药.....	(59)
阿托品 东莨菪碱 阿托品的合成代替品(后马托品)	
横纹肌松弛药.....	(62)
神经节阻断药.....	(63)
四、拟肾上腺素药.....	(63)
去甲肾上腺素和肾上腺素 麻黄硷 甲氧胺 苯肾上腺素 间羟胺 异丙肾上腺素 萘唑啉	
第七章 抗高血压药物.....	(67)
抗肾上腺素能神经药.....	(67)
利血平	
神经节阻断药.....	(68)
直接松弛血管平滑肌的药物.....	(68)
肼苯哒嗪 地巴唑	
利尿降压药.....	(69)
氯噻嗪类	
第八章 血管扩张药.....	(70)
一、亚硝酸化合物及硝酸酯类.....	(70)
二、烟酸.....	(71)
三、罂粟硷.....	(71)
第九章 强心药.....	(72)
第十章 作用于血液与造血系统的药物.....	(77)
一、止血药与抗凝血药.....	(77)
维生素K 安特诺新(安络血) 凝血质 仙鹤草素 6-氨基己酸	
二、治疗贫血的药物.....	(79)
铁剂 维生素B ₁₂ 及肝浸膏 叶酸	
第十一章 利尿药和脱水剂.....	(82)
一、利尿药.....	(82)
双氢克尿噻 汞撒利 安体舒通 氨苯喋啶	
二、脱水剂.....	(85)
甘露醇和山梨醇 尿素	
第十二章 作用于消化系统的药物.....	(86)
一、健胃药.....	(86)

二、助消化药.....	(86)
稀盐酸 胃蛋白酶 胰酶 表飞鸣	
三、制酸药.....	(87)
四、解痉药.....	(88)
五、泻药.....	(88)
机械刺激性泻药.....	(88)
硫酸镁 硫酸钠	
化学刺激性泻药.....	(89)
蓖麻油 双醋酚汀	
润滑性泻药.....	(89)
六、止泻药.....	(89)
鞣酸蛋白 次碳酸铋 药用炭	
第十三章 作用于呼吸系统的药物.....	(91)
一、镇咳祛痰药.....	(91)
(一) 镇咳药.....	(91)
咳必清 可待因 甘草	
(二) 祛痰药.....	(92)
1. 盐类祛痰药—氯化铵、碘化钾	
2. 恶心性祛痰药	
3. 刺激性祛痰药	
二、止喘药.....	(92)
(一) 直接作用于支气管平滑肌的药物.....	(92)
氨茶碱	
(二) 拟肾上腺素药.....	(93)
肾上腺素 异丙肾上腺素 麻黄碱	
(三) 肾上腺皮质激素.....	(93)
第十四章 子宫药和避孕药.....	(94)
一、子宫药.....	(94)
垂体后叶制剂 麦角制剂 益母草 当归	
二、避孕药.....	(95)
口服短效避孕药 炔雌醇 长效避孕药	
第十五章 抗组织胺药.....	(98)
第十六章 肾上腺皮质激素和促肾上腺皮质激素.....	(99)
去氧皮质酮类 可的松类 促肾上腺皮质激素 (ACTH)	
第十七章 甲状腺及抗甲状腺药物、降血糖药和性激素类药物.....	(103)
一、甲状腺及抗甲状腺药物.....	(103)
甲状腺制剂 硫脲类 碘及碘化物	
二、胰岛素及其代用品.....	(105)

胰岛素 口服降血糖药 甲苯磺丁脲 (D860) 氯磺丙脲 苯乙双胍 (降糖灵)	
三、性激素制剂.....	(107)
雌激素 孕激素 雄激素 苯丙酸诺龙	
第十八章 抗恶性肿瘤药物.....	(109)
细胞毒类.....	(109)
氮芥 (恩比兴) 氧氮芥 (癌得命、癌得平) 环磷酰胺 (癌得星、安道生)	
溶肉瘤素 (刹可利嗪), N—甲酰溶肉瘤素 (N—甲) 三乙撑硫代磷酰胺 (噻替派) 白消安 (马利兰, 米埃罗生, 白血福恩)	
抗代谢药类.....	(111)
叶酸拮抗剂: 氨甲喋呤 (氨甲基叶酸)	
嘌呤拮抗剂: 6—巯基嘌呤 (硫嘌呤, 6—MP, 乐疾宁)	
嘧啶拮抗剂: 5—氟尿嘧啶 (5—Fu)	
抗肿瘤抗菌素.....	(113)
争光霉素 (博莱霉素) 自力霉素 (丝裂霉素) 更生霉素 (放线菌素D)	

第一章 总 論

一、以毛泽东思想为指针，为創造我国統一的新医学新药学而奋斗！

“中国医药学是一个伟大的宝库，应当努力发掘，加以提高”。伟大领袖毛主席这一光辉指示及一系列关于卫生工作的方针、政策，照亮了我国医药学发展的道路，指明了为創造我国統一的新医药学而奋斗的航向。

叛徒、内奸、工贼刘少奇及其在卫生部门的代理人顽固对抗毛主席的无产阶级革命路线，他们代表剥削阶级的利益，以民族虚无主义对待祖国医药遗产，他们排斥、取缔中医，摧残、扼杀中药，对民间的草药验方更是不屑一顾，使卫生工作只为少数城市老爷服务。

史无前例的无产阶级文化大革命，彻底摧毁了刘少奇修正主义路线，在毛主席无产阶级革命路线指引下，学习和使用中草药的群众运动正在蓬勃兴起，並創造了一个又一个医药学史上的奇迹，广大革命医务人员深刻地认识到：以毛泽东思想为指针，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，創造我国統一的新医药学，是发展我国医药科学唯一正确的途径。

中草药和西药，各有防治疾病的理论和实践经验，自成系统，但各有所长，各有所短，两者都不能偏废，都不能取而代之。中草药能因地制宜，就地取材，经济、方便，打起来炸不烂，烧不光，而且对各种常见病、多发病有较好的疗效，深受劳动人民的欢迎。而西医药是伴随现代自然科学的发展而发展起来的医药学，它在抗病斗争中也累积了很多的经验，可是它受资产阶级形而上学和机械唯物论的影响，也存在不少错误的东西。为了使我国医药学得到迅速发展，我们必须遵照毛主席“古为今用”、“洋为中用”、“推陈出新”的方针，在医疗实践中认真地把中草药和西药结合起来，取长补短，提高疗效，总结经验，並上升为理论，形成我国統一的新医学新药学，攀登医药科学的新高峰！

随着全国应用单方、验方、中草药防治疾病的群众运动蓬勃兴起，中草药对保障人民健康占着愈来愈重要的地位。毛主席教导我们“人民要求普及，跟着也就要求提高”。就中草药来说：从战备的观点出发，对其某些剂型，不符合战备要求。再者，某些疗效好，应用广的中草药，由于自然条件的限制，其产量远远不能满足医疗工作的迫切需要。此外，中草药在防治疾病中的作用是确切无疑的，然而它为什么有效？广大医务工作者迫切要求以现代药理学研究方法阐明作用的机理。为了解决上述提出的问题，我们必须用现代科学知识和方法

改革剂型，提出有效成份，搞清化学结构，进而用人工合成方法合成它，並阐明其作用机理。这样才能寻找更为理想，具有“三效”（高效、速效、长效）“三小”（毒性小、成本小、用量小）和“五方便”（生产、运输、使用、携带、保管方便）的药物。因此，我们既要重视从自然界不断地发掘天然药物；也要重视发展人工合成、化学制药，从研究天然药物中发掘出来的成果，进而用现代科学知识和方法加以提高，发明创造出更好、更多的药品，才能使我们在抗病斗争中，更能自由，更能主动，更好地为保障劳动人民的健康服务。

当前，摆在我们各级医务人员面前的一项光荣而艰巨的任务，就是要尽快地实现毛主席关于中西医结合的光辉指示，创造中国统一的新医学新药学。我们坚决相信，用毛泽东思想武装起来的中国人民最聪明，有志气、有能力，一定能在不久的将来，创造出中国统一的新医学新药学，为中国人民和世界人民作出更大的贡献，“我们的目的一定要达到”，“我们的目的一定能够达到”。

二、药物作用的基本规律

（一）药物的作用

药物作用是指药物对人体和病原体的影响。药物进入人体后，是怎样发挥作用的呢？伟大领袖毛主席教导我们：“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”。在治疗疾病中，药物是外因，它们必须通过人的内因才发挥作用的。因此，革命医务人员，在医疗实践中，不仅要精心诊断，对症下药，为病人战胜疾病创造良好的外因条件，而且还要十分重视调动病人的内因，特别是对病人做好政治思想工作，使病人具有崇高的精神世界，革命乐观主义，始终具有战胜疾病的坚强战斗意志，从而焕发起身体各部份器官、组织的旺盛机能，调动和增强机体内部的抗病因素，“让体内慢慢生长抵抗力和它作斗争直至最后战而胜之，”使药物充分发挥作用。相反，资产阶级医学“权威”和我们队伍中有些同志单纯强调药物的治疗，迷信药物，滥用药物，把某些比较稀少的“新药”和“贵药”，看作是治疗中的“王牌”，对药物陷入盲目性，这实际上反映了一种信药不信人的“唯物质论”。对于这种思想不能简单地看作是一个单纯医疗技术问题，而应该看作是两种世界观、两条路线斗争在我们卫生队伍中反映的一个方面。我们必须用阶级斗争和路线斗争的观点来提高认识，才能克服形而上学的观点，树立辩证唯物论的观点，努力用毛泽东思想武装病人，针对病人存在的思想情况，做过细的政治思想工作。革命的医务人员和革命的患者应为革命而共同努力战胜疾病。

毛主席教导我们：“矛盾着的对立的双方互相斗争的结果，无不在一定条件下互相转化。在这里，条件是重要的。没有一定的条件，斗争的双方都不会转化。”药物是促进矛盾转化的条件。所谓药物的作用，或称药理作用，一般就是指机体在药物影响下所出现的种种改变。从总的来看，药物作用可以概括以下三种形式。

1. 调节功能：

机体某种机能的兴奋和抑制，这是矛盾着的两个方面，彼此对立而统一地保持机体的相

对平衡。但在一定条件下又可相互转化，在一般疾病的发展过程中，往往表现为机体某些功能的过低或过高，此时，药物作用的主要方式则是兴奋或抑制人体的某些功能，使其恢复平衡。过高的机能活动，需要降低至或接近正常水平称镇静（例如镇静、抗惊厥、解热镇痛药等）。过低的机能活动，需要提高至正常水平称兴奋（例如苏醒、强心药等）。过度抑制，使机能活动接近停止而不易恢复的称麻痹。过度的兴奋往往呈惊厥，最后可以转入衰竭状态称超限抑制。

2. 对抗感染：

对于病原微生物或寄生虫所致的疾病，要用抗感染药，帮助机体对病原体的抑制或杀灭。

3. 补充物质：

对于各种原因引起的营养缺乏病或某种生理物质的不足，首先要查清发病的原因，从根本上得到治疗，同时补充机体所缺少的物质，例如维生素、激素等。

应当注意，在疾病的发展过程中，变化是复染的。在许多变化中，必须抓住主要矛盾，由于它的存在和发展，规定和影响其它变化的存在和发展，例如强心药治疗充血性心力衰竭时，由于直接作用于心肌，改变心脏的功能，此为“直接作用”，由于心肌功能与血液循环改善的结果，而呼吸困难与水肿消退则为“间接作用”。所以我们必须针对用药，才能抓住主要矛盾，达到“治本”的目的。

物质代谢是一切组织功能活动的基础，所以药物对机体的影响，就是药物对机体物质代谢的影响。由于不同的药物，具有不同的化构，不同的组织，又有不同的结构，所以人体的各种组织与药物接触后，对药物的敏感性有很大差别，某些组织对某种药物特别敏感，这样就表现出选择作用。例如洋地黄对心脏具有高度的选择作用，麦角对子宫有兴奋作用而对其它器官很少影响。每种药物所以各有其不同的适应症及毒性，就是由于其不同的选择作用的缘故。与选择作用相反，有些药物无选择性，能对所有组织细胞都有类似作用，故称普遍细胞作用，例如酚类。临床上为了达到治疗目的，往往要求选择作用较高的药物。

毛主席教导我们：“事物都是一分为二的”，药物的作用也是这样，它可以对人体有利的一面，也可以对人体有不利的一面，临床上称前者为治疗作用，后者为不良反应。不良反应包括付作用、毒性反应、变态反应和继发反应。

1. 付作用：是指药物治疗剂量时，伴随治疗作用出现的其他作用，例如阿托品有松弛平滑肌和抑制腺体分泌等作用，用于解除胃肠痉挛引起的疼痛时，其松弛平滑肌的作用为治疗作用，抑制腺体分泌而引起的口干为付作用，但当用作麻醉前给药以抑制腺体分泌时，松弛胃肠平滑肌而引起的腹胀就成了付作用。所以“我们必须学会全面的看问题，不但要看到事物的正面，也要看到它的反面。在一定的条件下，坏的东西可以引出好的结果，好的东西也可以引出坏的结果。”因此，只有对药物作用有全面的了解，才能正确地使用药物。

2. 毒性反应：危害比较严重，一般在用药过量时才出现，所以严格掌握剂量是十分重要的。但是药物的治疗作用和毒性作用是矛盾着的两个方面，而治疗作用是矛盾的主要方面，尽管有些药物毒性很大，但是为了抢救病员的需要，也要在密切观察下正确使用。“然而这种情形不是固定的，矛盾的主要和非主要的方面互相转化着，事物的性质也就随着起变化。”当我们一旦发现毒性作用转化为矛盾的主要方面时，则要当机立断，放弃使用，改用其他药物。

3. 变态反应(特异质反应、过敏反应): 可通过抗原——抗体反应而发生, 只是在特异质的个体可以见之, 对于一般人, 即用中毒剂量亦不发生。

4. 继发反应: 为治疗作用所引起的不良后果, 故又称治疗矛盾, 例如使用抗菌素抑制肠道某些敏感细菌的生长繁殖, 使细菌失去正常的平衡关系, 而使另外部份不敏感的细菌大量繁殖起来, 引起另外一种感染, 临床上称之为二重感染的发生。

(二) 药物在体内的过程(体内经历)

药物进入机体后, 一方面药物对机体产生各种作用, 影响机体的功能; 另一方面, 机体改变药物(空间及结构), 对药物进行一系列的处理, 并决定其在体内的变化过程。因此, 我们学习药物在体内过程的目的, 是根据各种药物在人体内运动过程的不同特点, 使之发挥最大的药效。

〔吸收〕

药物和机体接触后, 在未被吸收入血流前可以在用药部位发生作用称为局部作用; 在被吸收进入血流后发生的作用称为吸收作用。一般来说, 吸收是药物发生作用的前提, 吸收的快慢, 取决于以下几个因素。

1. 给药途径: 按吸收速率由快到慢的次序: 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, 皮肤表面用药, 一般难以吸收, 总之血流丰富之处, 吸收较快, 反之则慢。

2. 药物理化性质: 脂溶性、水溶性药物容易吸收, 但水溶液较油溶液更易吸收; 胶状液、不溶性物质不易吸收。但也有少数药物, 虽然溶解, 但在胃肠道内吸收很少, 如硫酸镁等。

3. 吸收环境: 消化道淤血时, 口服不易吸收, 影响疗效。胃肠道内食物的存在, 可以影响疗效, 为了提高疗效, 应饭前给药, 但饭后给药可以减轻药物对胃肠粘膜的刺激性, 故有刺激的药物不宜空腹服, 例如水合氯醛、氨茶碱等。一般易被酸、硷或消化酶破坏的药物, 例如肾上腺素、青霉素等, 口服吸收很少, 须采用其他给药途径。

〔分布〕

药物吸收至血液后, 随着血液循环分布于全身, 但分布到各器官的浓度不一致, 有的比较均匀的分布全身, 如磺胺嘧啶; 有的集中的分布在某些组织, 如氯喹多在肝脏, 碘化钾多在甲状腺。有些药物不易通过血脑屏障, 如青霉素、磺胺嘧啶等。所以有时要按其分布的特点来选药, 治疗流行性脑脊髓膜炎, 多选用磺胺嘧啶, 因它在脑脊髓液内的浓度高于磺胺嘧啶。

〔代谢〕

由于机体不断地进行着复杂的代谢过程, 药物进入机体后, 在参与机体生化过程而发挥作用的同时, 多数也被机体所改变称为代谢, 也称生物转化, 代谢的主要场所在肝脏, 使大多数药物通过氧化、还原、分解、结合等方式失去其作用, 毒性也降低。当肝脏功能不佳时, 药物的代谢受到一定的影响, 如仍按常规给药, 可能导致中毒, 此时需酌减药量或减少给药次数。

〔排泄〕

无论药物在体内是否经过变化, 最后都要从机体排出。排泄药物的主要途径是肾脏, 其

次是胃肠道（胆汁）、肺、汗腺、乳腺等，故对肾功能障碍的病人，要注意防止积蓄中毒。排泄速度与药物在体内停留时间有关，故排泄快的必须频繁给药才能维持体内有效浓度，排泄慢的维持作用时间较长。例如ST的排泄速度较SMP为快，为了维持血中有效浓度ST需每隔四小时给药一次，而SMP只需每日给药一次。因此，长效制剂的试制成功是剂型改变的新动向，目前试制成功有“长效抗疟药”、“长效抗菌素”、“长效止痛片”等新药。

（三）影响药物作用的因素

毛主席教导我们：“世界上的事情是复杂的，是由各方面的因素决定的，看问题要从各方面去看，不能只从单方面看。”药物的作用也不是绝对的、静止的、孤立的、不变的，它受各方面的因素所制约，例如药物方面的因素，机体方面的因素，都可以影响药物的疗效。

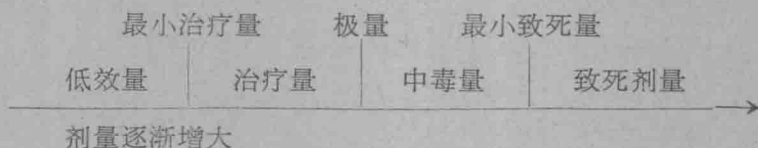
〔药物方面的因素〕

1. 药物的化学结构：有机药物有比较复杂的化学结构，与其药理作用有着密切的关系。有些药物具有相似的化学结构，可以呈现类似的药理作用，例如磺胺类等药物，其药理作用基本相同，但由于侧链的化学基团不同，因而在作用强度上仍然有所不同。根据化学结构和药理作用关系的研究，可以合成许多新药品，这也是发展现代药物新品种的重要途径。

另外，也有些药物虽然具有类似的化学结构，药理作用却完全不同，甚至有相反的作用，例如氨苯磺胺和对氨基苯甲酸的化学结构虽然很相似，却呈现对抗作用。

2. 药物的剂量：毛主席说：“不懂得注意决定事物质量的数量界限，一切都是胸中无‘数’，结果就不能不犯错误。”同一药物因剂量不同，药物的作用不但可以发生“量”（强度）的变化，而且可发生“质”的变化（药物变毒物）。例如巴比妥类药物随着剂量的增加可产生镇静、催眠、麻醉，更大剂量则可因麻痹作用而导致死亡。因此药物的剂量是否准确和适当，在临床治疗中十分重要。

现将剂量与作用的关系表示如下：



一般常用的“治疗量”是对大多数人有治疗作用的剂量，而“极量”是治疗量增加的最大限度，超过此极量易致中毒，治疗量与极量是根据临床经验而定的。《药典》中都有规定。

有些药物不能或不易用理化方法准确测定其含量，则用生物学实验方法测定其效价，从而测定一定制剂中药物的含量，此称生物检定。常用“单位”表示，如胰岛素、脑垂体后叶素等。国际公认的称为国际单位。

3. 药物的配伍作用

如果二种或二种以上的药物一起使用，有时互相发生影响，产生相似或相反的作用，则因其配伍作用的结果，或为相加，或为相减，分别称为协同作用和对抗（拮抗）作用。增强作用是协同作用的一种特殊形式，其配伍作用大于相加。如巴比妥类、吗啡与麻醉药配伍应用，可减少麻醉药的用量和因麻醉出现的副作用，呈协同作用；戊四唑可兴奋呼吸中枢而对抗巴比妥对呼吸中枢的抑制，呈拮抗作用。

〔机体因素对药物作用的影响〕

“任何运动形式，其内部都包含着本身特殊的矛盾。这种特殊的矛盾，就构成一事物区别于他事物的特殊本质。”机体因素除人的政治思想觉悟和精神因素对药物作用有影响之外，由于年龄、性别、体质等反应性的不同，机体对药物的反应各有不同。

1. 年龄、性别和体重：

一般所指药物的治疗量，是对成人（18—60岁）而言。儿童及老年人对于药物的反应与成年人不同，例如儿童对吗啡特别敏感，而对有些药品如阿托品、磺胺类都有强大的耐受性。老年人对催吐药、泻药和升压药比较敏感。妇女有其生理上的特殊情况，对不少药物的反应与一般情况有所不同，例如在月经或妊娠期间不宜用泻药、利尿药等以免引起月经过多，早产或流产。妊娠早期的子宫对催产素和麦角制剂不敏感或敏感性较低，而到了妊娠末期敏感性却显著增高。此外孕妇用药后，有些药物有经过胎盘进入胎儿体内的可能；授乳期妇女用药后，药物有经过乳汁进入乳儿体内的可能性。均应注意。

小儿剂量可参考下表及公式：

老 幼 剂 量 折 算 表
（根据《中华人民共和国药典》1963年版）

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—一个月	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）酌定剂量。

按体重儿童剂量计算法：

$$\begin{aligned}\text{儿童剂量} &= \frac{\text{儿童体重（公斤）}}{50} \times \text{成人剂量} \\ &= \text{成人剂量} \times 2 \times \text{儿童体重（公斤）} \times 1\%\end{aligned}$$

〔附〕儿童体重估计法

1岁以下小儿体重：

1—6个月小儿体重（克）=3000克（出生时体重）+月龄×600

7—12个月小儿体重（克）=3000克（出生时体重）+月龄×500

1 岁以上小儿体重:

体重(公斤) = $2 \times \text{年龄} + 7$

2. 个体差异:

在年龄、体重和性别等相同的情况下, 个体对药物的反应仍然不同, 这就是个体间的差异。按照其差异的情况, 可有以下几种情况。

高敏性: 是机体对药物的敏感性高于一般个体的表现, 只要用很小的剂量就可以引起较强的作用, 这是个体对药物反应上量的不同。例如一般人每日应用奎宁 1 克, 才发生耳鸣、重听等反应, 而高敏性的病人, 奎宁每日剂量 0.3—0.5 克便出现同样反应。

特异质: 是个体的体质特殊, 对药物的反应与一般个体相比有质的差别。这种反应称为特异质反应, 通常也称过敏反应, 呈现一般过敏性的症状, 如有人服用阿司匹林后, 即有哮喘、皮疹和粘膜充血等现象。严重时可有过敏性休克(如青霉素)。这种现象在一般个体即使用至中毒剂量, 也不会发生。

耐受性: 和高敏性相反, 对于药物的敏感性低于一般个体, 须用较大剂量, 甚至用到一般个体中毒的剂量时, 才发生治疗作用。耐受性也有先天性和后天性的差别, 前者长期存在不易改变, 后者是重复用药产生, 停止用药后经过一定的时间可以消失。后天耐受性一般在几天内产生, 其在几小时内就产生的称为快速耐受性, 如麻黄素。

习惯性与成瘾性: 在重复用药产生耐受性之后, 一旦停药, 个体有继续应用该药的愿望, 而无明显的戒断症状者, 称为习惯性。例如吸烟、饮酒和喝茶等。如果停药后有严重的戒断症状(流泪、鼻涕等)出现者, 称为成瘾性。例如吗啡等。成瘾药属麻醉药品, 须严加控制和管理。

抗药性: 指病原体对有些化学药物或抗菌素重复应用亦可产生敏感性降低而失效, 这种现象称为抗药性(耐药性)。必须尽力设法加以避免, 如青霉素对金黄色葡萄球菌的抗药性已经有不断增加的趋势。

3. 病理因素:

不同的病理状态, 可使药物呈现不同的作用。所以用药前应该先有明确的诊断, 然后对症下药, 始能得到满意的疗效。例如退热药只能使发热者退热, 不影响正常体温。肝、肾功能减退时, 可以影响某些药物的代谢和排泄, 而增强药物在体内的蓄积, 应加注意。

药典规定的剂量, 一般情况下不许超过。毛主席说: “按照实际情况决定工作方针”。例如药典规定阿托品的一次极量是 1 毫克, 一日极量是 3 毫克, 但目前在抢救有机磷农药中毒、流脑等时, 大大超过了药典规定的剂量, 才能使病人转危为安, 由此说明, 药物的剂量在不同的病理条件下, 由于变化的根据, 内因是不相同的, 故药物的剂量在特定的条件下, 具有一定的相对性。

第二章 抗病原微生物药

毛主席教导我们：“矛盾着的双方，依据一定的条件，各向着其相反的方向转化”。临床在应用抗菌药物的过程中，病人、病原体和抗菌药物三者的关系极为复杂，为了战胜疾病必须充分分析和处理人、菌、药三者的矛盾。既要充分发挥药物的抗菌作用，又不使病原菌对药物产生抗药性；既要看到药物有利的一面（即防治疾病的作用），又要看到它不利的一面（即还存在一定的不良反应）；既要认识药物是促进疾病向健康发展的重要条件，又不忽视战胜疾病主要是靠机体内部的抗病能力。

应用抗菌药的目的是为了治病救人，如果应用不当，就可导致相反的结果。文化大革命前，在刘少奇修正主义路线影响下，部分医务人员滥用抗菌药物的现象相当严重：有的人对抗菌药物的适应症认识不足，把抗菌素当作治百病的“万灵药”；有的人为了达到治疗上的“保险”往往采用“头头堵”的办法；有的人对细菌产生耐药性的问题认识不足，当使用无效时，不加具体分析，就盲目的加大剂量；也有的人由于害怕抗菌素的不良反应而缩手缩脚，对于应该使用抗菌药物的病人也不敢使用。以上种种错误做法不仅浪费药物，延误病情，而且会增加抗药性、不良反应，甚至使病情恶化，给患者带来严重恶果。

为了正确处理人、菌、药三者的矛盾，使抗菌药物更好地为保障人民健康服务，我们必须用毛主席的哲学思想指导医疗实践，充分发挥病人的主观能动性，并且对病人、病原菌和药物三方面都有个全面和过细的了解，以便能针对具体病情，体具的病原菌，选用适当的药物和剂量，做到用得稳、用得准。

一、磺胺类

磺胺类药物应用于临床已三十余年。磺胺药的出现，对抗感染治疗起了很大的作用。近年来，虽然由于抗菌素的发现及应用取代了部分磺胺类药的地位，但是磺胺类药物疗效肯定，用途广泛，价格低廉，不良反应较轻，因此至今它仍不失为抗感染治疗中的重要武器之一。

〔构效关系〕



一般有强大抗菌作用的磺胺类药物，都有一个共同的基本母核—磺胺（它的化学结构含有氨基、苯基和磺酰胺基三部分，见构造式）。当 N^1 上的一个氢原子被适当基团取代后，得到一系列衍化物，则药物的毒性降低，抗菌效力增强；当 N^4 上的一个氢原子被取代时，则作用减弱变为无效，必须在体内离解，将游离的氨基恢复，始发挥抑菌作用，现将常用的磺胺类药物列表于下：

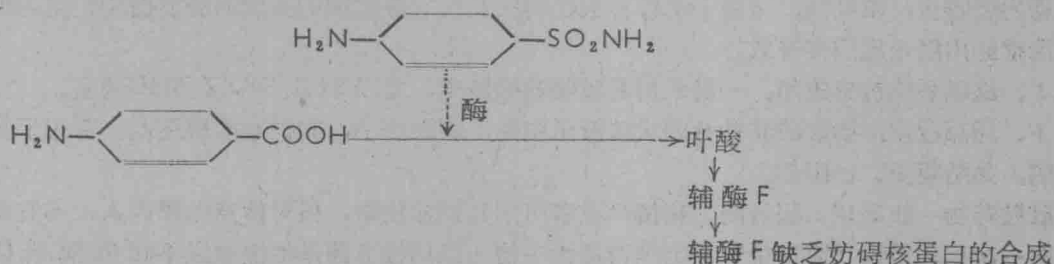
临床常用的磺胺类药物

药名	简名	磺胺母核被取代的部分	吸收情况
磺胺	S N	—	吸收
磺胺噻唑	S T	N^1	吸收
磺胺嘧啶	S D	N^1	吸收
磺胺甲基嘧啶	SM ₁	N^1	吸收
磺胺二甲基嘧啶	SM ₂	N^1	吸收
磺胺醋酰	SA(SC)	N^1	吸收
磺胺异恶唑（茵得清）	S I Z	N^1	吸收
磺胺甲基异恶唑	S M I Z	N^1	吸收
磺胺异二甲嘧啶	S M D	N^1	吸收
磺胺甲氧嘧啶（长效磺胺）	S M P	N^1	吸收
磺胺二甲氧嘧啶	S D M	N^1	吸收
磺胺咪（磺胺胍）	S G	N^1	少吸收
肽磺胺噻唑（羧苯甲酰磺胺噻唑）	P S T	N^4 N^1	少吸收
肽磺胺醋酰（息拉米）	P S A	N^4 N^1	少吸收
琥珀酰磺胺噻唑	S S T	N^4 N^1	少吸收
克泻痢宁	O Q P S T	N^4 N^1	少吸收

〔抑菌机制〕

一般认为对氨基苯甲酸为细菌代谢必需物质，是合成叶酸的原料，有了叶酸，细菌才能合成其生长繁殖所必需的核蛋白。但细菌在利用对氨基苯甲酸的过程中，需要细菌体内某些酶的参与。磺胺类药物因化构与对氨基苯甲酸相似，能与其争夺酶系统，妨害了细菌利用对氨基苯甲酸促进蛋白质的合成，因而细菌的生长繁殖停止。

磺胺类药物抑菌简图



〔体内过程〕

1. 吸收率：临床上常用的磺胺类药物，根据其吸收的情况，可分为两大类：一类是肠道容易吸收，服药后2~4小时血中浓度达到高点，目前在抗全身感染应用上常见的有ST、SD、SM₁、SM₂、SIZ、SMIZ、SMP；另一类肠道内不易被吸收，(N⁴)氢原子被取代的化合物，一般很少被吸收，目的在肠道内抗感染用，有PST、PSA、SST、及OQPST。SG大约被吸收服药量的50%。

2. 血浆蛋白结合率：磺胺类药物吸收后，除一部分游离外，一部分与血清蛋白结合，这种结合虽然对抗菌作用的影响不大，但与蛋白结合后，分子变大，不易通过血脑屏障，举例如下：

药 物	血 浆 蛋 白 结 合 率	脑脊液中的浓度达血中浓度的%
S T	55~80%	30%
S D	20~60%	50%

3. 乙酰化率：磺胺类药物在肝脏中可以形成N⁴-乙酰化合物而失去作用，在尿中的溶解度降低，易从肾脏析出结晶，产生肾结石，使尿道阻塞。ST的乙酰化率较高。乙酰SD的溶解度高于SD，但SD本身的溶解度很低，因此亦有产生结石的危险，但比ST安全。

4. 再吸收率：磺胺类药物及乙酰化合物几乎全部由肾脏排泄，排泄的速度决定于肾脏对药物的再吸收率，ST排泄最快，SD、SM₁、SM₂中等，SMP最慢。

〔抗菌谱及临床应用〕

这类药物的抗菌谱基本相似，对脑膜炎双球菌、肺炎双球菌、葡萄球菌、痢疾杆菌、大肠杆菌、鼠疫杆菌、沙眼病毒均有抑制作用。其中葡萄球菌、痢疾杆菌、大肠杆菌产生耐药性的菌株较多。目前常用于：

1. 全身抗感染用：对以上敏感菌引起的感染，常用的药物有ST、SD、SM₁、SM₂、SIZ、SMIZ、SMD、SMP等。选用那一种磺胺药，应根据病情轻重和病人对药物的反应情况而定。ST作用可靠，价格低廉，故应用广泛，但不良反应较其它磺胺药为多，排泄快以及不易通过血脑屏障等缺点。SD疗效高，排泄慢、血中浓度维持较久，且易通过血脑屏障，这有利于对脑膜的治疗。SIZ、SMIZ、SMP与SD基本相似。SMP作用发生慢为其缺点，但血中维持时间长，故服药次数少以及比较经济为其优点。磺胺二甲氧嘧SDM是一种新的长效磺胺，其作用、用途、用法与SMP相同。

2. 肠道抗感染用：常用的磺胺药有SG、PSA、PST、SST及克泻痢宁。这类药的共同特点是肠内吸收少，浓度高，可用于治疗杆菌性痢疾及其它敏感细菌所致的肠道感染。克泻痢宁对治疗肠内阿米巴病亦有效。

3. 泌尿系统抗感染用：一般采用易吸收的磺胺类，尤以SIZ、SMIZ、SMD为宜。

4. 局部应用：磺胺醋酰钠盐的水溶液呈中性，刺激性小，其钠盐溶解度高，常用于眼科疾病，如结膜炎、砂眼等。

磺胺药物一般采用口服给药。病情严重者可其钠盐注射，但对休克无尿病人，不宜使用。第一次用药采取“突击量”（比维持量大一倍）以后按各药排泄快慢以不同间隔给以