



中等卫生职业教育规划教材

ZHONGDENG WEISHENG ZHIYE JIAOYU GUIHUA JIAOCAI



药物应用基础



郭 华 主编

YAO WU YING YONG JI CHU



湖北科学技术出版社

供中等卫生职业教育各专业用

中等卫生职业教育规划教材

ZHONGDENG WEISHENG ZHIYE JIAOYU GUIHUA JIAOCAI

药物应用基础

YAOWU YINGYONG JICHU

主 编 郭 华

副主编 黄金敏 范怀河

编 者 (按姓氏笔画排序)

万进军 鄂州职业大学

王 玮 襄樊市护士学校

何 涛 荆州职业技术学院

宛 菁 武汉大学医学院职业技术学院

范怀河 咸宁卫生学校

孟 军 湖北职业技术学院

赵甲英 十堰市医药卫生学校

郭 华 鄂州职业大学

黄金敏 荆州职业技术学院

颜国祥 仙桃职业学院

湖北科学技术出版社

图书在版编目（C I P）数据

药物应用基础 / 郭华主编，—武汉：湖北科学技术出版社，2010.7
中等卫生职业教育规划教材
ISBN 978-7-5352-4497-0

I. ①药… II. ①郭… III. ①药理学—专业学校—教材 IV. ①R9
中国版本图书馆 CIP 数据核字（2010）第 089324 号

责任编辑：冯友仁封面设计：戴 旻

出版发行：湖北科学技术出版社电话：027-87679468

地 址：武汉市雄楚大街 268 号邮编：430070

（湖北出版文化城 B 座 12-13 层）

网 址：<http://www.hbstp.com.cn>

印 刷：湖北睿智印务有限公司邮编：430011

787×10921/1614.25 印张346 千字

2010 年 7 月第 1 版2010 年 7 月第 1 次印刷

定价：25.00 元

本书如有印装质量问题 可找本社市场部更换

目 录

第一章 总论	1
第一节 绪言	1
一、药物和药物应用基础的概念	1
二、学习药物应用基础的方法	2
三、应用药物的注意事项	2
第二节 药物对机体的作用——药效学	3
一、药物的基本作用	3
二、药物作用的基本类型	4
三、药物作用的机制	6
四、药物作用的受体机制	6
第三节 机体对药物的作用——药动学	8
一、药物的跨膜转运	9
二、药物的体内过程	10
三、血药浓度动态变化的时间过程	14
第四节 影响药物作用的因素	17
一、机体方面的因素	17
二、药物方面的因素	19
三、给药方法方面的因素	21
四、联合用药与药物相互作用	23
第二章 抗微生物药	26
第一节 概述	26
一、主要术语	26
二、抗菌药的合理使用	27
第二节 抗生素	28
一、 β -内酰胺类	28
二、大环内脂类、林可霉素类和其他抗生素类	33
三、氨基糖苷类和多黏菌素类	36
四、四环素类和氯霉素	38
第三节 人工合成抗菌药	40
一、喹诺酮类	40
二、磺胺类药物与甲氧苄啶	41
三、其他合成抗菌药	42
第四节 抗结核病药	44

第五节 抗真菌药和抗病毒药	47
一、抗真菌药	47
二、抗病毒药	49
第六节 消毒防腐药	50
一、酚类	51
二、醇类	51
三、醛类	52
四、酸及其盐类	52
五、卤素类	52
六、氧化剂类	53
七、染料类	54
八、表面活性剂类	54
第三章 抗寄生虫病药	55
第一节 抗疟药	55
一、疟原虫生活史及抗疟药的作用环节	55
二、常用抗疟药	56
第二节 抗阿米巴病药及抗滴虫病药	57
一、抗阿米巴病药	57
二、抗滴虫病药	58
第三节 抗肠虫药	59
第四节 抗血吸虫病药和抗丝虫病药	60
一、抗血吸虫病药	60
二、抗丝虫病药	60
第四章 抗恶性肿瘤药	62
第一节 抗恶性肿瘤药物概述	62
一、细胞增殖周期	62
二、抗恶性肿瘤药的作用分类	62
三、抗恶性肿瘤药物的主要不良反应	63
四、抗肿瘤药物的用药注意事项	63
第二节 常用的抗恶性肿瘤药物	64
一、破坏 DNA 结构和功能的药物	64
二、影响核酸生物合成的药物	65
三、干扰转录过程和阻止 RNA 合成的药物	66
四、抑制蛋白质合成的药物	67
五、影响激素功能的药物	67
第三节 抗恶性肿瘤药物的应用疗法	68
第五章 传出神经系统药物	70
第一节 传出神经系统药物概论	70
一、传出神经系统按递质的分类	70
二、传出神经系统受体的类型、分布及生理效应	71

第二节 胆碱受体激动药	73
一、M 胆碱受体激动药	73
二、抗胆碱酯酶药	74
第三节 M 胆碱受体阻断药	77
一、阿托品和阿托品类生物碱	77
二、阿托品的合成代用品	80
第四节 肾上腺素受体激动药	81
一、 α 、 β 受体激动药	81
二、 α 受体激动药	84
三、 β 受体激动药	86
第五节 肾上腺素受体阻断药	87
一、 α 肾上腺素受体阻断药	87
二、 β 肾上腺素受体阻断药	89
第六章 麻醉药	92
第一节 局部麻醉药	92
一、局麻药的作用	92
二、局麻药的应用方法	93
三、常用局麻药	93
第二节 全身麻醉药	95
一、吸入性麻醉药	95
二、静脉麻醉药	96
三、复合麻醉	97
第七章 中枢神经系统药物	99
第一节 镇静催眠药	99
一、概述	99
二、苯二氮草类	99
三、巴比妥类	100
四、其他镇静催眠药	101
第二节 抗癫痫药和抗惊厥药	102
一、抗癫痫药	102
二、抗惊厥药	104
第三节 抗精神失常药	105
一、抗精神病药	105
二、抗躁狂症与抑郁症药	107
三、抗焦虑药	107
第四节 镇痛药	108
一、阿片类生物碱	108
二、人工合成镇痛药	109
三、其他镇痛药	110
四、阿片受体拮抗剂	110

第五节 解热镇痛抗炎药·····	111
一、药物分类·····	111
二、常用药物·····	111
第六节 中枢兴奋药·····	113
一、主要兴奋大脑皮层的药物·····	113
二、主要兴奋延脑呼吸中枢的药物·····	115
第八章 抗组胺药和作用于子宫药物·····	116
第一节 H_1 受体阻断药·····	116
第二节 子宫兴奋药物·····	118
第九章 作用于消化系统的药物·····	121
第一节 抗消化性溃疡药·····	121
一、抗酸药·····	121
二、抑制胃酸分泌药·····	122
三、胃黏膜保护药·····	122
四、抗幽门螺杆菌药·····	123
第二节 助消化药·····	123
第三节 止吐药·····	124
第四节 泻药·····	124
第五节 止泻药·····	125
第十章 作用于呼吸系统的药物·····	128
第一节 平喘药·····	128
一、 β_2 受体激动药·····	128
二、茶碱类药·····	129
三、M 胆碱受体阻断药·····	130
四、糖皮质激素类药·····	130
五、肥大细胞膜稳定药·····	130
第二节 镇咳药·····	131
第三节 祛痰药·····	132
第十一章 利尿药及脱水药·····	134
第一节 利尿药·····	134
一、肾脏泌尿生理及利尿药作用部位·····	134
二、常用的利尿药·····	136
第二节 脱水药·····	138
第十二章 心血管系统药物·····	140
第一节 抗高血压药·····	140
一、抗高血压药物的分类·····	140
二、常用抗高血压药·····	141
三、其他抗高血压药·····	144
四、抗高血压药的应用原则·····	146
第二节 抗慢性心功能不全药·····	147

一、正性肌力药	147
二、肾素-血管紧张素-醛固酮系统抑制药	149
三、减轻心脏负荷药	150
四、 β 受体阻断药	150
第三节 抗心律失常药	151
一、心脏电生理学基础	151
二、抗心律失常药的基本电生理作用及药物分类	153
三、常用抗心律失常药	154
四、抗快速型心律失常药的选用	157
第四节 抗心绞痛药	159
一、硝酸酯类及亚硝酸酯类	159
二、 β 受体阻断药	160
三、钙拮抗药	160
第五节 调血脂药与抗动脉粥样硬化药	161
一、HMG-CoA 还原酶抑制药	162
二、胆汁酸结合树脂	162
三、烟酸	162
四、苯氧酸类	162
五、多烯不饱和脂肪酸类	163
六、抗氧化剂	163
七、保护动脉内皮药	163
第十三章 作用于血液及造血器官药	165
第一节 促凝血药	165
第二节 抗凝血药	165
第三节 溶栓药	166
第四节 抗贫血药	167
第五节 血容量扩充剂	168
第十四章 维生素	170
第一节 水溶性维生素	170
第二节 脂溶性维生素	174
第十五章 激素类药物	177
第一节 肾上腺皮质激素类药物	177
一、糖皮质激素类药	177
二、盐皮质激素类药	180
第二节 甲状腺激素及抗甲状腺药	181
一、甲状腺激素	182
二、抗甲状腺药	183
第三节 胰岛素及口服降血糖药	185
一、胰岛素	186
二、口服降血糖药	187

第四节 计划生育用药	189
一、避孕药	189
二、终止妊娠药	191
第十六章 解毒药	193
第一节 有机磷酸酯类中毒的解救	193
一、中毒机制	193
二、中毒症状	193
三、中毒解救药	194
第二节 金属和类金属中毒的解救	195
第三节 氰化物中毒的解救	197
药物应用基础实验	198
实验一 药物剂量对药物作用的影响	198
实验二 不同的给药途径对药物作用的影响	198
实验三 链霉素的急性中毒及氯化钙的对抗作用	199
实验四 磺胺类药物的溶解性	200
实验五 传出神经系统药物对兔瞳孔的作用	201
实验六 传出神经药物对兔血压的影响	202
实验七 普鲁卡因的传导麻醉作用	203
实验八 地西洋抗惊厥作用	204
实验九 尼可刹米对呼吸抑制的解救	204
实验十 呋塞米的利尿作用	205
实验十一 硝酸甘油的扩血管作用	206
实验十二 普萘洛尔的抗缺氧作用	207
实验十三 枸橼酸钠的抗凝血作用	208
实验十四 缩宫素对小白鼠离体子宫的作用	208
实验十五 地塞米松的抗炎作用	209
实验十六 有机磷农药中毒及解救	210
附录	211
附录一 药物一般知识简介	211
附录二 处方与医嘱简介	213
参考文献	217

第一章 总 论

第一节 绪 言

✧ 学习目标

1. 掌握药物和药物应用基础的概念。
2. 熟悉药物两重性和用药注意事项。
3. 了解药物应用基础的学习目的和学习方法。

一、药物和药物应用基础的概念

药物是指用于预防、治疗、诊断疾病和计划生育的化学物质。《药物应用基础》是学习药物的作用、应用、不良反应、用法、用药注意事项等一门医学基础课程。药物和药物应用基础是两个不同的概念，前者是阐述用于防治疾病的特殊物质，强调其特殊物质性；后者是阐述如何去认识、应用药物这种特殊物质的基本理论、基本知识和基本技能，更强调其知识性和职业技能性。

药物是人类与疾病作斗争的重要武器之一，而药物对疾病的防治，是药物和机体相互作用的结果。任何药物都具有两重性，既可产生对人体有益的作用，如防病治病；同时又可产生对人体不利的影响，如不良反应。药物的利弊是可知的，不良反应的发生率，常常与不合理使用密切相关。因此，我们学习药物应用基础这门课程的目的，在于基本掌握常用药物的作用、用途、不良反应、用法、用量及注意事项，为继续学习专业知识和职业技能；为将来在工作中合理用药，扬长避短，化害为利，充分发挥药物的医疗效益、社会效益和经济效益打下良好的基础。

延伸知识

1. 药品 其内涵是指用于预防、治疗、诊断疾病、有目的地调节人体生理功能、并规定有适应证或者功能主治、用法、用量的物质。其外延包括中药材、中药饮片、中成药、化学原料药及其制剂、抗生素、生化药品、放射性药品、血清、疫苗、血液制品和诊断药品等。显然，药品与药物最重要的区别在于规定了适应证及用法用量，并有一定规格和剂型的制剂，更强调其商品性。但是，在日常生活中人们习惯将两者相互通用。

2. 药理学 是指研究药物与机体间相互作用与作用规律的一门科学。药理学与药物应用基础相比较，两者均以药物为对象、以药物的药动学和药效学内容作平台，论述药物的作用、用途、不良反应、用法、用量及注意事项等。但侧重点不同，药理学要阐



延伸知识

述药物应用机体的来龙去脉，要求知其然和所以然，突出其研究性；而药物应用基础仅叙述如何去应用药物，仅要求知其然，强调其实用性。

3. 药物、食物、毒物三者关系 通俗地讲，药物是用于生活机体防治疾病的物质；食物是生活机体生存与繁衍的能量物质；毒物是对生活机体有损害的物质。这是根据药物的使用目的和剂量多少等来界定其区别的；当然，又可以根据某种意义而言，不能将药物与食物截然分开。很多食物能起到良好防治疾病的作用，常言道药食同源，缺什么补什么很在理。例如，玉米油能起到预防冠心病、辅助治疗高血压的作用；糖盐水能使虚脱患者转危为安；并且，糖又能诱发加重糖尿病、盐水过多对高血压和肾功能不全患者能加重症状等，此时糖与盐似乎又是有害物。事实上，有很多药物是来自毒物，如蛇毒能溶血栓、三氧化二砷能抗癌、有机磷农药 1605 能治顽固性青光眼等。此外，值得明确的是吗啡、度冷丁等，用于临床被视为特殊药品，依法供给；如果滥用被视为毒品，会遭到依法严重打击。

二、学习药物应用基础的方法

1. 联系基础医学知识 药物应用基础是建立在基础医学知识之上的一门综合课程，与解剖、生理生化、微生物、寄生虫等课程有密切联系。在学习每一类型药物时，要有针对性地联系相关基础医学知识，对于理解和掌握药物基础知识有事半功倍的效果。例如，抗生素的分类、作用、机制与细菌的结构和功能相联系等。

2. 联系临床医学知识与实践 药物应用基础是由基础医学向临床医学过渡之间的桥梁课程。每种药物的作用、用途、不良反应、用法、用量与合理用药等，都能在临床实践中表现出来，联系起来学习，可以提高药物的应用能力与技能。例如，阿托品用于胃肠平滑肌痉挛并引起口干等。

3. 掌握药物的共性与个性特点 药物的品种很多，且每种药物均有其作用、用途、不良反应、用法用量等。若从单个药物进行学习显得零乱，易混淆，难记忆，不易掌握。如果先将药物分类，并比较同类药物的共性，再区别各个药物的个性，能达到概念清晰，记忆牢固，有利于合理应用。例如，抗胆碱类药物阿托品、山莨菪碱、东莨菪碱等，作用大同小异，如果合理应用各自大不相同，甚至有本质的区别。其中，选择东莨菪碱用于麻醉前给药，既能抑制腺体分泌，又能抑制中枢神经系统，产生一举两得的效果。

4. 重视实验 药物实验是教学的重要组成部分。由于药物的作用是先从动物实验中总结出来，再在临床中得到验证的。认真进行药物动物实验和临床实践，既能验证药物基础理论，加深理解，增强记忆，提高学习兴趣，还有助于训练学生动手操作能力和培养观察分析事物的能力。

三、应用药物的注意事项

在给患者的用药过程中，作为实用型医药护技等医务人员，既是药物诊治疾病的实施者，也是用药前后的监护者。这就要求大家，要掌握一定的药物应用基础知识和技能，协助医生做好疾病的诊治工作，遵循“安全、有效、合理、经济”的用药原则，充分发挥药物的疗效，尽量减少药物的不良反应，使药物达到最佳的治疗效果。因此，应用药物时必须注意

如下事项。

1. 用药之前 要了解医生对患者的诊断、医嘱、处方等情况，如果有疑问要随时询问医生；要了解患者的病情，辅助检查结果，病史，用药史，有无禁忌证；要掌握所用药物的作用，给药途径，用法、用量，不良反应及防治措施等。

2. 给药之时 首先对照处方看清楚药品名称，仔细进行药品的外观检查，核对用药批号和有效期、浓度、剂量和给药途径；联合用药有无配伍禁忌，严格按照医嘱给患者用药，准确掌握剂量和用药方法，避免技术性事故的发生；其次要注意观察患者用药疗效和不良反应，发现问题及时处理，避免药源性疾病的发生。

3. 全程药学服务 在用药之前、用药之中、用药之后的全过程中，要为患者和家属提供药学服务。例如，介绍有关防病及药疗知识，服药时间，有关饮食注意事项，防止饮食不当对药物疗效的影响，说服患者及家属积极配合治疗，提高依从性和药物治疗效果。

4. 特殊人群 同样的疾病、同样的药物、同样的给药途径，在特殊人群中，有时产生很大的差异性，容易引起不良反应。例如，老年人对升压药和很多解热镇痛药反应敏感；小儿对氨基糖苷类、氯霉素类等抗生素反应敏感；妇女在妊娠期和哺乳期，均对抗感染药和神经系统用药等反应敏感；体弱多病者对任何药物都可能反应敏感。因此，在人群中不能照本宣科，生搬硬套地应用药物。

复习思考题

1. 比较说明药物与药物应用基础的概念及其区别有哪些？
2. 学习药物应用基础的目的和用药注意事项有哪些？

第二节 药物对机体的作用——药效学

✱ 学习目标

1. 掌握药物的作用、药物的基本作用、药物作用的类型中的一些基本概念。
2. 熟悉受体、受体激动剂与受体阻断剂等基本概念。
3. 了解药物作用机制。

药物对机体的作用，简称药物的作用，是指药物与机体组织间的初始作用；药物的效应是指药物初始作用引起机体器官原有功能的改变（即是药物作用的结果、也是机体反应的表现）。例如，肾上腺素能与心脏的 β 受体结合并激动受体，是其药物的作用；同时引起心率加快、心肌收缩力加强，皮肤黏膜及内脏血管收缩等，是其药物的效应。药物的作用与药物的效应，是前因后果的关系，但经常是将两者互相通用，严格地讲是有区别的。药物效应动力学，简称药效学，是指研究药物对机体的作用规律和作用机制的科学。同样，药物的作用与药效学的鉴别点在于前者注重应用性，后者更侧重于研究性。一般情况，药效学与药物的作用也是互相通用，它是研究与学习药物的主要内容，也是药物应用的重要依据。

一、药物的基本作用

药物的基本作用是指药物对机体功能活动的影响。其表现形式为兴奋作用与抑制作用两方面。

1. 兴奋作用 是指能使机体组织器官原有生理功能增强的作用。例如,肾上腺素能兴奋心脏和升高血压;咖啡因能兴奋中枢神经系统和心脏;干扰素能提高机体的免疫功能等。

2. 抑制作用 是指能使机体组织器官原有生理功能活动减弱的作用。例如,吗啡能产生镇痛和呼吸抑制;普萘洛尔能使心脏抑制和血压降低;阿托品有抑制腺体分泌和松弛胃肠平滑肌的作用等。

兴奋作用与抑制作用在一定条件下可以相互转化。过度兴奋会引起惊厥不止;长时间的惊厥会转为衰竭性抑制,解除抑制之后,也可能发生“反跳现象”;过度抑制使功能活动接近停止,称“麻痹”。

二、药物作用的基本类型

药物作用的表现形式多种多样,为了便于学习与理解,可以从不同的角度来归纳如下。

(一) 局部作用和吸收作用 (按作用范围分)

1. 局部作用 是指药物与机体接触后未吸收入血液,仅在用药部位所出现的作用。例如,酒精、碘酒等对皮肤黏膜的消毒作用;普鲁卡因的局麻作用;口服抗酸药和导泻药等,其所产生的作用均为局部作用。

2. 全身作用 又称吸收作用,是指药物从给药部位吸收进入血液后,分布到机体各个部位而发生的作用。例如,口服地西洋呈现镇静催眠作用;口服或肌肉注射阿莫西林抗全身感染;直肠给药小儿退热栓等,产生的药物效应均为全身作用。

药物局部作用与全身作用是相对的,在某些情况下可以互相转变。例如,局麻药丁卡因,如果局部给药过量过久,可吸收产生心脏的毒性作用;点滴去甲肾上腺素时,如果操作时不慎外漏,使局部组织血管强烈收缩,导致局部组织坏死。

(二) 直接作用和间接作用 (按作用方式分)

1. 直接作用 又称原发作用,是指药物在所分布的组织器官直接产生的作用。例如,强心苷对心脏的正性肌力作用;消毒防腐药对环境的消杀病原微生物的作用。

2. 间接作用 又称继发作用,是指直接作用而引发的其他作用。例如,去甲肾上腺素有升高血压、并可产生减慢心率的作用。前者是激动了血管平滑肌上 α 受体的结果,属于直接作用;后者是其使血压升高引起降压反射的结果,属于间接作用。

(三) 选择作用和普遍细胞作用 (按作用的特定对象分)

1. 选择作用 是指药物进入机体后对不同组织器官的作用性质或作用强度方面的差异。例如,强心苷对慢性心功能不全的心脏,有高度的选择性作用,小剂量就能产生正性肌力作用,但对正常心脏的作用不明显;对骨骼肌和平滑肌,即使应用很大剂量也无作用。

任何药物都有其特定适应证和不良反应,药物作用选择性常是药物分类的依据,也是临床选择用药的基础。掌握药物的选择作用和适应证,有利于做到对症下药,减少不良反应,发挥药物的最佳疗效。

2. 普遍细胞作用 是指药物对与它所接触的组织器官都有类似的作用。其作用特点是:选择性低,作用广泛,毒性较强。由于这类药物大多数对细胞原生质产生损伤性毒害,故又称为“原生质毒”或“细胞原浆毒”。例如,酚对细菌和人体蛋白质均可使其变性;恶性肿瘤的化疗,不良反应多见且严重,也是由于其对机体组织细胞和癌细胞均有杀伤作用。

(四) 药物作用的双层性

药物作用具有双层性,既可产生对机体有利的防治作用,也可能产生对机体不利的不良反应。两者之间往往是相互联系,伴随发生的两种作用性质完全不同的表现形式。

1. 治疗作用 是指药物所产生的符合用药目的的作用,是有益于防治疾病的作用。根据治疗作用的效果,又分为对因治疗与对症治疗。

(1) 对因治疗 也称治本或特效治疗,是指消除原发致病因素,彻底消除疾病的治疗。例如,青霉素对某些病原微生物有杀灭作用;甲硝唑能抗阴道毛滴虫和阿米巴原虫等。

(2) 对症治疗 也称治标,是指改善疾病的症状,减轻患者的痛苦的治疗。例如,度冷丁有镇痛作用;阿司匹林有解热镇痛的作用;抗酸药有中和胃酸的作用等。对症治疗虽然不能消除病因,但在某些危重急症,如休克、惊厥、心力衰竭、高热、剧痛时,对维持生命体征,争取时间采取对因治疗措施至关重要。

在临床实践中,对因治疗与对症治疗,两者不能偏颇,应该根据患者的具体情况灵活运用。遵循祖国医学“急则治其标,缓则治其本,标本兼治”的原则,指导救死扶伤,妥善处理对因治疗与对症治疗关系。

2. 不良反应 是指不符合用药目的,给患者带来不适或痛苦的反应。根据发生情况,归纳为以下几种。

(1) 副作用 是指药物在治疗剂量时出现的和用药目的无关的作用。给患者带来的不适或者痛苦,一般症状较轻,危害不大。产生的原因是由于药物的选择性较低,作用较广所致。

每种药物的副作用和防治作用不是固定不变的,当其中一种作用被用于治疗目的时,其他效应则成为副作用。例如,用阿托品解除胃肠平滑肌痉挛性疼痛的同时,由于抑制腺体分泌,出现口干舌燥等副作用;当阿托品作为麻醉前给药时,其抑制腺体分泌的作用则成为防治作用,而松弛平滑肌,引起术后肠麻痹和尿潴留则成为副作用。

因此,一般情况下副作用是可以预知的,并可以减轻或避免。例如,用麻黄碱治疗哮喘时,可导致失眠,同时给镇静催眠药,可以对抗其中的中枢兴奋作用。

(2) 毒性反应 是指药物引起对机体有损害甚至危及生命的反应。发生的原因或者用药剂量过大、或者用药时间过久、或者机体对药物敏感性特别强等因素所致。老人、小儿、孕妇、体质弱者等,是药物毒性反应的易发特殊人群。例如,链霉素类抗生素对小儿,易损害听神经而致耳聋;氯霉素抑制骨髓造血功能而引起贫血等。

短期内过量用药所引起的毒性反应,称为急性毒性,多损害循环、呼吸和神经等系统的功能。长期用药使其在体内蓄积而引起的毒性,称为慢性毒性。多损害肝、肾、内分泌等功能。药物“三致”(致畸、致癌、致突)作用,属于慢性毒性中的特殊毒性。

(3) 过敏反应 又称为变态反应,是指机体受药物刺激后发生的异常免疫反应。其发生与药物的剂量大小和作用的强弱无关,而与过敏体质有关,临床症状相似。常见表现有皮疹、药热、哮喘等,严重者可引起过敏性休克发生。

因此,临床上应用青霉素、链霉素、普鲁卡因等药物时,一般依次做到:一问(有无过敏史)、二试(皮试)、三观察(观给药后的反应)、四备救(急救措施的准备)等,是防治药物过敏反应发生的操作程序。

(4) 后遗效应 是指停药后,血药浓度降到有效浓度以下残存的药物效应。例如,睡前服用巴比妥类催眠药,次日早晨起床后,仍有头晕、困倦、嗜睡等宿醉现象,这时,喝点浓茶可缓解其现象。

(5) 继发性反应 又称治疗矛盾,是继发于药物治疗作用之后的一种不良反应。例如,长期应用广谱抗生素,导致菌群失调症,而出现二重感染现象。

(6) 停药反应 又称反跳现象,是指长期用药而突然停止用药后,而出现比原有疾病加

剧的现象。例如，长期应用 β 受体阻断药普萘洛尔抗高血压，若突然停药，而出现血压骤升，心律失常，甚至产生急性心肌梗死或者猝死。

(7) 药物依赖性 是指某些药品直接作用于中枢神经系统，产生兴奋或抑制效应，出现强迫性使用或定期使用药物的行为。根据药物使人产生的依赖性和危害人体健康的程度，通常分为精神依赖性和躯体依赖性两种。

1) 精神依赖性 又称心理依赖性或者习惯性，是指持续用药突然停药，在精神上出现渴望连续用药的行为，以求达到舒适满足感。能引起精神依赖的药物称之为精神药品。例如，镇静催眠药、某些中枢兴奋药、某些解热镇痛药等，均可产生精神依赖性。

2) 躯体依赖性 又称生理依赖性或成瘾性，是指反复用药造成身体适应状态，产生欣快感，突然停药就会出现戒断症状。其表现为烦躁不安，流涎、流泪、流汗，腹痛、腹泻，困倦，背部和肢体疼痛，肌肉抽搐等综合征，甚至危及生命。有强烈再次用药的欲望，会不择手段地获得这类药物。这对个人、家庭和社会容易造成极大的危害性。例如，吗啡、度冷丁等，临床与科研上称之为麻醉药品，依法管理和使用；若社会上滥用则称之为毒品，会遭到法律的打击。古今中外，没有例外。

三、药物作用的机制

药物作用的机制是阐述药物为什么起作用 and 如何起作用诸方面的问题。在药物应用基础课中，了解药物作用机制，有利于理解药物作用和不良反应，更好地指导临床安全、有效、合理地用药。

药物是通过影响机体的生理生化过程而发挥作用的。机体的功能复杂，且药物的种类繁多，性质各异。因此，药物作用的机制也是多种多样，列表 1-1 简要介绍如下。

表 1-1 药物作用机制小结表

分类	说 明	举 例
改变理化性质	某些药物用后使细胞周围环境的理化性质改变而发挥作用	①口服碳酸氢钠中和胃酸，用于缓解消化性溃疡疼痛症状；②甘露醇提高血浆渗透压治疗脑水肿
影响细胞代谢过程	某些药物参与或干扰细胞代谢过程而发挥作用	①铁剂参与血红蛋白的形成，治疗缺铁性贫血；②氟脲嘧啶能渗入恶性肿瘤细胞，干扰蛋白质的合成，发挥抗癌作用
改变酶的活性	某些药物改变酶的活性而发挥作用	①卡托普利抑制血管紧张素转化酶而发挥抗高血压作用；②解磷啶能使受抑制的胆碱酯酶复活而解救有机磷农药中毒
影响膜通透性	某些药物影响生物膜离子通道的通透性而发挥作用	①普鲁卡因能稳定细胞膜钠通道，产生局部麻醉作用；②硝苯地平阻断细胞膜钙通道而扩张血管和抗高血压作用
影响免疫功能	某些药物经抑制免疫或提高免疫功能而发挥作用	①环孢素能选择性抑制 T 细胞的增殖与分化，具有提高抗排斥作用；②白细胞介素-2，具有增强免疫功能的作用
影响自身活性物质	某些药物影响激素、神经递质、自身活性物质而发挥作用	①阿司匹林抑制前列腺素的合成而呈现解热镇痛和抗炎作用；②大剂量的碘抑制甲状腺素分泌而发挥抗甲亢作用
通过受体	详见下文药物作用的受体机制	详见下述药物作用的受体机制

四、药物作用的受体机制

受体理论是从分子生物学水平阐明生命现象的生理和病理过程，是解释药物的作用、作

用机制、药物分子构效关系的一种基本理论。

(一) 受体

受体是指存在于细胞膜上或细胞膜内的大分子蛋白质，能识别并特异性地与配体结合，产生特定的生物效应。配体是指神经递质、激素及药物等。

(二) 药物与受体的相互作用

药物与受体结合起来后，产生效应，必须具备两种特性：一是有药物与受体结合的能力，即亲和力；二是药物与受体结合后产生效应的能力，即内在活性。于是，可将药物分成三类。

1. 受体激动剂 是指与受体有较强亲和力，又有较强内在活性的药物。作用特点：能兴奋受体，产生明显效应。例如，吗啡激动阿片受体，产生镇痛作用。

2. 受体拮抗剂 是指与受体有较强的亲和力，但缺乏内在活性的药物。作用特点：能与受体结合，不能兴奋受体，不产生效应，但能阻断激动剂和受体的结合，与激动剂有对抗作用。例如，纳洛酮本身无明显药理作用，但在体内与吗啡竞争同一受体，产生对抗吗啡的药理作用。

3. 受体部分激动剂 是指与受体有一定亲和力，而内在活性较弱的药物。作用特点：与受体结合后，只能产生较弱的效应，即使增加浓度，也不能达到完全激动剂那样最大效应。相反因占领受体，并削弱激动剂的部分作用，即表现出部分阻断作用。所以，部分激动剂具有激动剂和拮抗剂的双重作用。例如，镇痛新可引起较弱的镇痛作用（效应），但与吗啡合用，可以对抗吗啡镇痛效应的发挥。



延伸知识

(一) 受体的特性

1. 高敏感性 只需要极微量的配体与受体结合，就能产生显著的效应。
2. 高选择性 一种特定的受体，只能与特定的配体结合产生特异的生物效应。
3. 高饱和性 受体数目有限，配体与受体结合表现出最大效应和竞争性抑制，具有饱和性。
4. 高可逆性 配体与受体结合是可逆的，配体迟早会从受体中解离出来，或被其他特异性配体置换。

(二) 药物的亲和力与内在活性的比较

简要介绍如图 1-1。

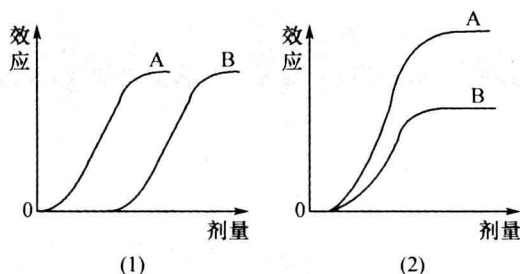


图 1-1 A、B 两药的亲和力与内在活性的比较

(1) 亲和力比较 (2) 内在活性比较

(1) 亲和力比较 在产生相同效应时，A 药的剂量小于 B 药，表明 A 药对受体的亲和力较大。

 延伸知识

(2) 内在活性比较 在相同的剂量时, A 药的效应大于 B 药, 表明 A 药对受体的内在活性较大。

(三) 作用于受体的药物特点比较

简要介绍见表 1-2。

表 1-2 作用于受体的药物特点比较

种类	亲和力	内在活性	效应力
受体激动剂	较强	较强	强
受体拮抗剂	较强	无	无
受体部分激动剂	比较强	较弱	弱

(四) 受体的调节与药物作用的关系

长期应用受体激动剂, 可产生药物耐受性, 是由于药物引起相应受体数目减少所致, 称之为向下调节。同样, 长期应用受体拮抗剂, 若突然停药, 可引起病情反跳性加重, 是由药物使受体数目反射性增加所致, 称之为向上调节。例如, 长期应用镇静催眠药、抗高血压药而突然停药, 可引起反跳现象。

复习思考题

1. 列出并熟悉药物作用的基本类型中有哪些基本概念?
2. 举例说明副作用与防治作用之间的关系。
3. 简述如何正确应用对因治疗和对症治疗。
4. 解释受体、受体激动剂和受体阻断剂的基本概念。

第三节 机体对药物的作用——药动学

✧ 学习目标

1. 了解药物的体内过程及其主要影响因素。
2. 熟悉量效关系、药酶、首过作用、肝肠循环、半衰期和稳态血药浓度的概念和意义。
3. 掌握药物剂量与效应之间的关系。

机体对药物的作用, 俗称药物体内过程, 是指机体对药物的吸收、分布、生物转化和排泄的过程。药物代谢动力学, 简称药动学, 是指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。其借助动力学原理和数学计算方法研究体内药物浓度的变化过程。药物体内过程与药动学共同点: 均是阐明药物吸收、分布、生物转化和排泄过程的特点, 为临床制定正确的用药方案提供依据; 不同点在于前者仅突出其实用性, 后者更强调其研究性。一般情况, 药物的体内过程与药动学相互通用。了解药物的体内过程及血药浓度随时间变化