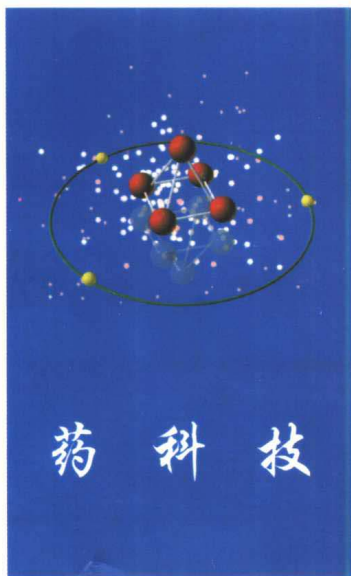


国家执业药师资格考试应试指南

# 药理学

国家药品监督管理局人事教育司 组织编写



中国医药科技出版社

执业药师应试指南

国家执业药师资格考试应试指南

# 药 理 学

国家药品监督管理局人事教育司 组织编写

主编 钱之玉

主审 李 端

编委 (以姓氏笔画为序)

朱东亚 肖继皋

芮耀诚 章蕴毅

中国医药科技出版社

登记证号：(京) 075 号

### 内 容 · 提 要

本书为《国家执业药师资格考试应试指南》之一——《药理学》。由国家药品监督管理局人事教育司组织有关专家教授根据国家药品监督管理局组织修订，国家人事部审定的《国家执业药师资格考试考试大纲》编撰。全书共9篇50章，重点介绍了药理学的基本概念与知识，对作用于人体各大系统的各类药物中的代表药或常用药从药动学、药理作用、作用机制、临床应用及不良反应5个方面进行了论述。并紧密结合实际，介绍了最新上市药物的作用机制。全书内容紧扣《考试大纲》，重点突出，叙述简明扼要，为执业药师资格考试应试人员必备用书。

### 图书在版编目(CIP)数据

药理学/钱之玉主编. —北京：中国医药科技出版社，  
2000.4

(国家执业药师资格考试应试指南/国家药品监督管理局人事教育司组织编写)

ISBN 7-5067-2241-0

I. 药… II. 钱… III. 药理学—药剂人员—资格考试—指南 IV. R96-62

中国版本图书馆CIP数据核字(2000)第07038号

中国医药科技出版社 出版  
(北京市海淀区文慧园北路甲22号)  
(邮政编码 100088)

北京市友谊印刷经营公司 印刷  
全国各地新华书店 经销

\*

开本 787×1092mm $\frac{1}{16}$  印张 20

字数 417千字 印数 1—30000

2000年4月第1版 2000年4月第1次印刷

---

定价：40.00元

## 国家执业药师资格考试大纲及应试指南

### 编审委员会

名誉主任委员 郑筱萸

主任委员 邵明立

副主任委员 金秀范 曹文庄 徐幼军

委员 (按姓氏笔画排列)

宁广荣 白慧良 朱长浩 朱景申

刘汉清 华维一 毕殿洲 吴立军

吴永佩 吴凯云 李 军 李 端

李家实 李舜年 杨世民 张世臣

张淑芳 金世元 陆丽珠 胡圣榆

郑 虎 赵 葆 姚新生 钱之玉

黄泰康 常章富 阎玉凝 董善年

谢秀琼 颜正华

## 前 言

中共中央在《关于建立社会主义市场经济体制若干问题的决定》中指出：“要制定各种职业资格标准和录用标准，实行学历文凭和职业资格两种证书制度，逐步实行公开招聘，平等竞争，促进人才合理流动。”据此，国家有关部门正式颁发《职业资格证书规定》。《规定》指出：“职业资格是对从事某一职业所必备的学识、技术和能力的基本要求。职业资格包括从业资格和执业资格。从业资格是指从事某一专业（工种）学识和能力的起点标准。执业资格是指政府对某些责任较大、社会通用性较强、关系公共利益的专业（工种）实行准入控制，是依法独立开业或从事某一特定专业（工种）学识、技术和能力的必备标准。”

药品是用于人类防病治病和康复保健的特殊商品。加强药品管理，提高药品质量，保障用药安全有效，是关系到人民身体健康的大事。因此，国家决定在药品生产、经营、使用单位实行执业药师资格制度，要求“凡从事药品生产、经营、使用的单位均应配备相应的执业药师，并以此作为开办药品生产、经营、使用单位的必备条件之一。”

根据中华人民共和国人事部、国家药品监督管理局人发〔1999〕34号文件精神，国家执业药师资格考试分为四个科目：①药事管理与法规；②药学（中药学）专业知识（一）；③药学（中药学）专业知识（二）；④药学（中药学）综合知识与技能。

为了配合国家执业药师资格考试，指导应试人员备考，依据国家药品监督管理局组织修订、中华人民共和国人事部审定的《国家执业药师资格考试考试大纲》，我司组织有关专家编写了国家执业药师资格考试应试指南，经国家执业药师资格考试大纲及应试指南编审委员会审定，共十二册，分别是《药理学》、《药物分析》、《药剂学》、《药物化学》、《中药学》、《中药药剂学》、《中药鉴定学》、《中药化学》、《药事管理》、《药事法规汇编》、《药学综合知识与技能》和《中药学综合知识与技能》。其中《药事法规汇编》、《药学综合知识与技能》和《中药学综合知识与技能》现为试用教材，拟通过实践进一步修订完善。

本套应试指南内容紧扣考试大纲，实用性强，作为各单位开展考前培训和应试人员必备的教材。

国家药品监督管理局人事教育司

2000年1月

## 编写说明

药理学是执业药师必备的药学专业知识的重要组成部分，也是国家执业药师资格考试药学专业四大科目之一。根据国家人事部和国家药品监督管理局《执业药师资格制度暂行规定》和《执业药师资格考试实施办法》精神和国家执业药师资格考试药理学《考试大纲》要求，特为国家执业药师资格考试命题、培训及应试人员编写了这本药理学应试指南。

编写药理学应试指南的依据是国家执业药师资格考试药理学《考试大纲》；应试指南的内容涵盖了药品使用、经营、生产领域执业药师必备的药理学知识；应试指南面对的主要读者是申请参加执业药师资格考试的应试者。应试者大多为药学本科毕业，已从事3年医药工作，或药学中专、大专毕业，已工作数年，他们曾主修过或选修过药理学。鉴于教材的特定限制和特定对象，本书的篇幅有较大的压缩，内容有较多的更动，有增有减。药物的化学结构、药物的剂量和用法基本删去，各种插图尽量减少；对各种药物中的代表药或常用药作了详细的介绍，对同类的其他药物，主要说明其药理作用特点或者列表比较。本书尽可能反映目前应市的新药。理论更新与新药评价在各篇中都有体现，尤其在心血管系统篇和化学治疗篇中更为突出。总之，药理学应试指南在编写过程中力求体现国家教委提出的教材必须具备思想性、科学性、启发性和实用性的要求，努力保持药理学的学科系统性，贯彻理论联系实际的原则，适当调整和充实较成熟的新理论和新药介绍，注意药理学发展新趋势。

药理学应试指南由药理学总论和各系统药理共九篇、五十章组成，重点介绍了药理学的基础理论、基本知识和基本技能。本指南应为培训或应试者的基本教材。将对应他们起到指导作用；也可成为他们日后工作中的参考书。希望考生掌握药效学和药动学的基本概念、主要内容和重要参数；掌握各类药物中的代表药或常用药的药动学、药理作用及作用机制、临床应用、不良反应及其防治；熟悉各类其他药物的药理特点；了解药理学的新进展，新理论及应市新药。

因编写工作时间仓促，加之限于我们的水平和能力，本书一定有不足或欠妥之处，恳请广大读者批评指正。

编者

2000年1月

# 目 录

## 第一篇 药理学总论

第一章 绪言	( 1 )
第二章 药效学	( 3 )
第一节 药物的基本作用	( 3 )
第二节 药物的量效关系	( 4 )
第三节 药物安全性评价	( 6 )
第四节 药物作用机制	( 7 )
第五节 药物与受体	( 8 )
第三章 药动学	( 12 )
第一节 药物体内过程	( 12 )
第二节 血药浓度变化的时间过程	( 16 )
第三节 药物消除动力学	( 18 )
第四章 影响药物效应的因素	( 21 )
第一节 药物方面的因素	( 21 )
第二节 机体方面的因素	( 22 )

## 第二篇 外周神经系统药理

第五章 传出神经药理概论	( 25 )
第一节 传出神经的递质	( 25 )
第二节 传出神经的受体	( 27 )
第三节 传出神经系统的生物效应	( 28 )
第四节 传出神经系统药物的作用方式和分类	( 29 )
第六章 胆碱受体激动药	( 31 )
第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	( 33 )
第一节 易逆性胆碱酯酶抑制剂	( 33 )
第二节 难逆性胆碱酯酶抑制剂	( 34 )
第三节 胆碱酯酶复活剂	( 35 )
第八章 胆碱受体阻滞药	( 36 )
第一节 M胆碱受体阻滞药	( 36 )
第二节 N <sub>1</sub> 胆碱受体阻滞药 - 神经节阻断药	( 39 )
第三节 N <sub>2</sub> 胆碱受体阻滞药 - 骨骼肌松弛药	( 39 )
第九章 肾上腺素受体激动药	( 42 )
第一节 $\alpha$ 受体激动药	( 42 )

第二节	$\alpha, \beta$ 受体激动药	(44)
第三节	$\beta$ 受体激动药	(46)
第十章	肾上腺素受体阻滞药	(48)
第一节	$\alpha$ 受体阻滞药	(48)
第二节	$\beta$ 受体阻滞药	(49)
第十一章	局部麻醉药	(52)

### 第三篇 中枢神经系统药理

第十二章	镇静催眠及抗惊厥药	(54)
第一节	苯二氮草类	(54)
第二节	巴比妥类	(56)
第三节	其他镇静催眠药	(57)
第四节	抗惊厥药	(57)
第十三章	抗癫痫药	(59)
第十四章	抗精神失常药	(62)
第一节	抗精神病药	(62)
第二节	抗躁狂抑郁症药	(65)
第三节	抗焦虑药	(68)
第十五章	抗帕金森病药	(69)
第一节	拟多巴胺类药	(69)
第二节	胆碱受体阻滞药	(71)
第十六章	镇痛药	(72)
第一节	阿片生物碱类镇痛药	(72)
第二节	人工合成镇痛药	(75)
第三节	非麻醉性镇痛药	(77)
第四节	阿片受体拮抗剂	(77)
第十七章	中枢兴奋药	(78)
第一节	主要兴奋大脑皮层的药物	(78)
第二节	主要兴奋延脑呼吸中枢的药物	(79)
第十八章	解热镇痛抗炎药	(80)
第一节	非选择性环加氧酶抑制药	(81)
第二节	选择性诱导型环加氧酶抑制药	(84)
第十九章	全身麻醉药	(85)
第一节	吸入麻醉药	(85)
第二节	静脉麻醉药	(86)

### 第四篇 心血管系统药理

第二十章	抗心律失常药	(87)
第一节	心律失常的电生理基础	(87)



第二节	常用抗心律失常药·····	( 90 )
第三节	抗心律失常药物的选择应用·····	( 97 )
<b>第二十一章</b>	<b>抗慢性心功能不全药·····</b>	<b>( 98 )</b>
第一节	强心苷·····	( 98 )
第二节	非苷类正性肌力药·····	( 103 )
第三节	血管紧张素 I 转化酶 (ACE) 抑制剂·····	( 104 )
<b>第二十二章</b>	<b>抗高血压药·····</b>	<b>( 106 )</b>
第一节	肾上腺素能神经阻断药·····	( 107 )
第二节	利尿降压药·····	( 111 )
第三节	血管扩张药·····	( 111 )
第四节	钙拮抗药·····	( 113 )
第五节	影响肾素 - 血管紧张素系统的降压药·····	( 113 )
第六节	其他抗高血压药·····	( 116 )
第七节	抗高血压药的选择应用·····	( 117 )
<b>第二十三章</b>	<b>抗心绞痛药·····</b>	<b>( 119 )</b>
第一节	有机硝酸酯类·····	( 119 )
第二节	$\beta$ -受体阻滞药·····	( 121 )
第三节	钙拮抗药·····	( 122 )
第四节	其他抗心绞痛药·····	( 125 )
<b>第二十四章</b>	<b>抗动脉粥样硬化药·····</b>	<b>( 130 )</b>
第一节	调血脂药·····	( 130 )
第二节	抗氧化药·····	( 135 )
第三节	多烯脂肪酸类·····	( 136 )
第四节	其他抗动脉粥样硬化药·····	( 137 )

## 第五篇 泌尿、血液、呼吸及其他系统的药理

<b>第二十五章</b>	<b>利尿药和脱水药·····</b>	<b>( 139 )</b>
第一节	利尿药·····	( 139 )
第二节	渗透性利尿药·····	( 143 )
<b>第二十六章</b>	<b>血液及造血系统药理·····</b>	<b>( 144 )</b>
第一节	抗贫血药·····	( 144 )
第二节	促凝血药和抗凝血药·····	( 144 )
第三节	纤维蛋白溶解药·····	( 146 )
第四节	抗血小板药·····	( 147 )
第五节	血容量扩充药·····	( 147 )
<b>第二十七章</b>	<b>祛痰、镇咳、平喘药·····</b>	<b>( 148 )</b>
<b>第二十八章</b>	<b>消化系统药理·····</b>	<b>( 152 )</b>
第一节	抗消化性溃疡药·····	( 152 )
第二节	助消化药·····	( 153 )

第三节	止吐药	(154)
第四节	泻药	(154)
第五节	止泻药	(155)
第六节	利胆药	(155)
第二十九章	组胺受体激动药和阻滞药	(156)
第三十章	子宫平滑肌兴奋药	(158)

## 第六篇 内分泌系统药理

第三十一章	肾上腺皮质激素类药	(160)
第一节	糖皮质激素类药	(160)
第二节	促皮质激素及皮质激素抑制药	(163)
第三节	盐皮质激素	(163)
第三十二章	性激素类药和避孕药	(164)
第一节	雌激素类药	(164)
第二节	抗雌激素类药	(165)
第三节	孕激素类药	(165)
第四节	雄激素类药和同化激素类药	(166)
第五节	避孕药	(167)
第三十三章	甲状腺激素及抗甲状腺药	(170)
第一节	甲状腺激素	(170)
第二节	抗甲状腺药	(170)
第三十四章	胰岛素及口服降血糖药	(173)
第一节	胰岛素	(173)
第二节	口服降血糖药	(174)

## 第七篇 抗病原微生物药物药理

第三十五章	抗菌药物概述	(176)
第一节	常用术语	(176)
第二节	抗菌药物的主要作用机制	(177)
第三节	细菌的耐药性	(179)
第四节	抗菌药物的合理选用	(180)
第三十六章	$\beta$ -内酰胺类抗生素	(183)
第一节	$\beta$ -内酰胺抗生素作用机制	(183)
第二节	青霉素类	(184)
第三节	头孢菌素类	(188)
第四节	非典型 $\beta$ -内酰胺类	(192)
第三十七章	大环内酯类、克林霉素及其他抗生素	(195)
第一节	大环内酯类抗生素	(195)
第二节	克林霉素	(197)

第三节	多肽类抗生素	(198)
<b>第三十八章</b>	<b>氨基苷类抗生素及多粘菌素</b>	(200)
第一节	氨基苷类	(200)
第二节	常用的氨基苷类抗生素	(201)
第三节	多粘菌素类	(204)
<b>第三十九章</b>	<b>四环素类和氯霉素类</b>	(205)
第一节	四环素类	(205)
第二节	氯霉素类	(207)
<b>第四十章</b>	<b>喹诺酮类药物</b>	(210)
第一节	喹诺酮类药物概述	(210)
第二节	各种喹诺酮类药物	(213)
<b>第四十一章</b>	<b>人工合成抗菌药</b>	(215)
第一节	磺胺类药	(215)
第二节	抗菌增效剂—甲氧苄氨嘧啶	(219)
第三节	硝基呋喃类药	(219)
<b>第四十二章</b>	<b>抗结核药和抗麻风病药</b>	(221)
第一节	常用抗结核药	(221)
第二节	抗结核病药应用原则	(224)
第三节	抗麻风病药	(225)
<b>第四十三章</b>	<b>抗真菌药</b>	(227)

## 第八篇 抗寄生虫病药物药理

<b>第四十四章</b>	<b>抗疟药</b>	(230)
第一节	疟原虫的生活史及药物作用环节	(230)
第二节	常用抗疟药	(231)
<b>第四十五章</b>	<b>抗阿米巴病药和抗滴虫药</b>	(236)
第一节	作用于肠内、外阿米巴病的药物	(236)
第二节	主要作用于肠腔内的阿米巴病药	(237)
第三节	主要作用于肠腔外阿米巴药	(238)
第四节	抗滴虫病药	(238)
<b>第四十六章</b>	<b>抗肠蠕虫药</b>	(239)
第一节	驱线虫药	(239)
第二节	驱绦虫药	(241)
第三节	驱肠虫药的合理选用	(241)
<b>第四十七章</b>	<b>抗血吸虫和抗丝虫病药</b>	(243)
第一节	抗血吸虫病药	(243)
第二节	抗丝虫病药	(244)

## 第九篇 抗肿瘤、抗病毒及免疫调节药物药理

第四十八章 抗肿瘤药	(246)
第一节 肿瘤细胞增殖周期和化疗药物作用的关系	(246)
第二节 抗肿瘤药的作用机制与分类	(247)
第三节 常用的抗肿瘤药物	(248)
第四节 抗肿瘤药物的合理应用	(259)
第四十九章 抗病毒药	(260)
第五十章 免疫抑制剂和免疫增强剂	(263)
第一节 免疫应答和免疫病理反应	(263)
第二节 免疫抑制剂	(264)
第三节 免疫增强剂	(265)
英文索引	(269)
中文索引	(281)

# 第一篇 药理学总论

---

## 第一章 绪 言

### 一、药理学的性质和任务

药理学 (pharmacology) 是研究药物与机体 (包括病原体) 相互作用的规律和机制的科学。药物 (drug) 是指能影响机体细胞的生理、生化或病理过程, 并用以预防、治疗和诊断疾病的物质。药理学既研究机体在药物影响下发生的生理生化变化及其机制, (称为药物效应动力学, 简称药效学) 又研究药物本身在体内的过程, (即机体如何对药物进行处置, 称为药物代谢动力学, 简称药动学)。可见, 药理学研究的主要对象是机体与药物, 属于广义的生理科学范畴。药理学是以生理学、生化学、病理学等为基础。它与主要研究药物本身的药学学科, 如药物化学、药剂学、制药学、生药学、药物分析等学科有明显的区别。药理学的学科任务是要为阐明药物作用机制、改善药物质量、提高药物疗效、开发新药、发现药物新用途并为探索细胞生理生化及病理过程提供实验资料。学习药理学的主要目的是要理解药物有什么作用、作用机制、临床用途及如何充分发挥其临床疗效并减少不良反应, 要理论联系实际了解药物在发挥疗效过程中的因果关系。

### 二、药理学的发展史

远古时代, 人们为了生存从生活经验中得知某些天然物质可以治疗疾病与伤痛, 这是人类认识药物的开始, 最初涉及的天然物质便是药物的始源。例如大黄导泻、麻黄止喘、常山治疟、楝实祛虫、柳皮退热等。更有传统药物的经典著作流传至今。例如在公元一世纪前后我国的《神农本草经》、埃及的《埃伯斯医药籍》(Ebers' Papyrus), 明朝李时珍的《本草纲目》(1596年) 等。

药理学的发展是与现代科学技术的发展密不可分的。英国解剖学家 W. Harvey (1578~1657年) 发现了血液循环, 开创了生理学新纪元。意大利生理学家 F. Fontana (1720~1805年) 通过动物实验对千余种药物进行了毒性测试, 得出了天然药物都有其活性成分, 选择作用于机体某个部位而引起典型反应的客观结论。这一结论以后为德国化学家 F. W. Sertürner (1783~1841年) 首先从罂粟中分离提纯吗啡所证实。18世纪后期有机化学的发展为药理学提供了物质基础, 从植物药中不断提纯其活性成分, 得到纯度较高的药物, 如依米丁、奎宁、士的宁、可卡因、阿托品、毛果芸香碱等。而后, 化学合成

药物开始起步，如德国微生物学家 P. Ehrlich 从大量有机砷化合物中筛选出治疗梅毒有效的新砷凡钠明（914 年），开创了化学治疗的新纪元。药理学作为独立的学科是从德国的 R. Buchheim（1820~1879 年）开始的，他建立了第一个药理实验室，写出第一本药理教科书。其学生 O. Schmiedeberg（1838~1921 年）继续发展了实验药理学，潜心研究药物的作用部位，开创了器官药理学。

有关受体的概念虽首先由英国生理学家 J. N. Langley（1852~1925 年）提出，但自 Ehrlich 开始才提出受体一词。而后受体理论不断被完善，成为推动药理学发展的巨大动力，也成了分子药理学研究的中心内容。近 30 年来，由于分子生物学、生物化学、细胞生物学、免疫学的发展及各种新技术在药理学中的应用，分子药理学腾飞而起，成为现代药理学的主流。

（朱东亚）

## 第二章 药 效 学

药物效应动力学 (pharmacodynamics) 简称药效学, 是研究药物对机体的作用及作用机制的科学。药效学重点讨论药物的生理及生化效应及其机制以及药物剂量与效应之间的关系。它不但是药理学的理论基础, 而且也是临床合理用药的依据。

### 第一节 药物的基本作用

#### 一、药物作用与药理效应

药物作用 (drug action) 是指药物与机体细胞间通过分子相互作用所引起的初始作用, 是动因, 有其特异性。如去甲肾上腺素与血管平滑肌细胞的  $\alpha$ -受体结合。药理效应 (pharmacological effect) 是药物作用引起机体生理生化的继发性改变, 是机体反应的表现, 对不同脏器有其选择性。如去甲肾上腺素引起的血管收缩、血压上升。因此, 药理效应实际上是机体器官原有功能水平的改变, 功能的提高称为兴奋, 功能的降低称为抑制。过度兴奋转入衰竭, 是另外一种性质的抑制。药物作用特异性强的药物不一定引起选择性高的药理效应, 二者不一定平行。例如阿托品特异性阻断 M 胆碱受体, 但药理效应选择性并不高, 对心脏、血管、平滑肌、腺体及中枢神经功能都有影响, 而且有的兴奋、有的抑制。作用特异性强及 (或) 效应选择性高的药物应用时针对性较好。反之, 效应广泛的药物副作用较多。

药物具有两重性, 既能治病也能致病。药物一方面可以改变机体的病理过程, 有利于疾病的治疗, 称为治疗效应, 简称疗效 (therapeutic effect); 另一方面也可以引起机体生理生化过程紊乱, 甚至器官组织的结构改变等危害机体的不良反应 (adverse reaction)。因此, 药理效应与疗效并非同义词。

#### 二、药物的治疗效应

药物作用所达到的治疗效应可分为:

1. 对因治疗 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 (etiological treatment)。例如抗生素杀灭体内病原微生物。

2. 对症治疗 用药目的在于改善疾病的症状称为对症治疗 (symptomatic treatment)。对症治疗未能根除病因, 但对于诊断未明或病因未明暂时无法根治的疾病却是必不可少的。在某些重危急症如休克、惊厥、心力衰竭、高热、剧痛时, 对症治疗可能比对因治疗更为迫切。所以在实际工作中, 这两种治疗相辅相成, 不可偏废。

#### 三、药物的不良反应

凡不符合用药目的并给病人带来不适或痛苦的反应统称为不良反应。多数不良反应是

药物固有药理效应的延伸，在一般情况下是可以预知的，但不一定是可以避免的。少数较严重的不良反应是较难恢复的，称为药源性疾病，例如庆大霉素引起神经性耳聋，胼屈嗪引起红斑性狼疮等。

药物的不良反应可分为：

1. 副作用 (side effect) 是指药物在治疗剂量时，机体出现的与治疗目的无关的不适反应。副作用是由于药物的药理效应选择性低、作用较广而引起，一般较轻微，且多数是可以恢复的机体功能变化。例如阿托品用于解除胃肠痉挛时，将会引起口干、心悸、便秘等副作用。药物的副作用是药物固有的药理效应，是在常用剂量下发生的，一般不太严重，可以预知但是难以避免的。

2. 毒性反应 (toxic effect) 是指在药物剂量过大或蓄积过多时机体发生的危害性反应，一般比较严重，但是可以预知，也是可以避免的一种不良反应。毒性反应可因剂量过大而立即发生，称为急性毒性；也可因长期蓄积后逐渐产生，称为慢性毒性。急性毒性多损害循环、呼吸及神经系统功能；慢性毒性多损害肝、肾、骨髓、内分泌等功能。致癌、致畸胎、致突变这三致反应也属于慢性毒性范畴。因此，企图增加剂量或延长疗程达到治疗目的是有限度的，过量用药是十分危险的。

3. 后遗效应 (residual effect) 是指停药后机体血药浓度已降至阈浓度以下时残存的药理效应。有时后遗效应非常短暂，例如服用长效巴比妥类催眠药后，次晨仍有“宿醉”现象。有时后遗效应也可能较持久，例如长期应用肾上腺皮质激素，由于其对垂体前叶的负反馈作用引起肾上腺皮质萎缩，一旦停药后，肾上腺皮质功能低下，数月内难以恢复。

4. 停药反应 (withdrawal reaction) 是指突然停药后原有疾病的加剧现象，又称为反跳反应 (rebound reaction)，例如长期服用可乐定降压药，停药次日血压可剧烈回升。

5. 变态反应 (allergic reaction) 是机体接受药物刺激后发生的不正常的免疫反应。药物 (非肽类药物) 多数为小分子化学物质，作为半抗原与机体蛋白结合为抗原后，经过敏感化过程，从而引起免疫反应，也称为过敏反应 (hypersensitive reaction)。变态反应常见于过敏体质的病人。临床表现各药不同，也因人而异。反应性质与药理效应无关，用药理拮抗药解救无效。反应严重程度差异很大，也与剂量无关，从轻微的皮疹、发热至造血系统抑制、肝肾功能损害、休克等。停药后反应逐渐消失，再用时可能再发。致敏物质可能是药物本身，可能是其代谢物，也可能是药物中的杂质。临床用药前常做皮肤过敏试验，但仍有少数假阳性或假阴性反应。

6. 特异质反应 (idiosyncrasy) 少数病人对某些药物反应特别敏感，反应性质也可能与常人不同，但与药理效应基本一致，反应严重程度与剂量成比例，药理拮抗药救治可能有效。这种反应不是免疫反应。现在知道这是一类遗传异常所致的反应，例如对骨骼肌松弛药司可林的特异质反应是由于先天性血浆胆碱酯酶缺乏。

## 第二节 药物的量效关系

药物剂量与其药理效应在一定范围内成比例，这就是剂量-效应关系 (dose-effect relationship)，简称量效关系。由于药理效应与血药浓度的关系较为密切，故在药理学研



究中更常用浓度-效应关系 (concentration-effect relationship)。

有些药理效应表现为连续的量变,称为量反应 (graded response),增减可用具体数量或最大反应百分率表示。例如血压的升降、平滑肌舒缩等。以药理效应为纵坐标,药物浓度为横坐标作图即得量效曲线。如将药物浓度改用对数值作图则呈典型的对称 S 型曲线 (图 2-1)。而有些药理效应只能用全或无,阳性或阴性表示称为质反应 (all-or-none response 或 quantal response),如死亡与生存、抽搐与不抽搐等,必需用多个动物或多个实验标本观察反应的阳性频率。用累加阳性频率或百分率为纵坐标,对数剂量或(浓度)为横坐标作图,则质反应的量效曲线也呈对称 S 型 (图 2-2)。

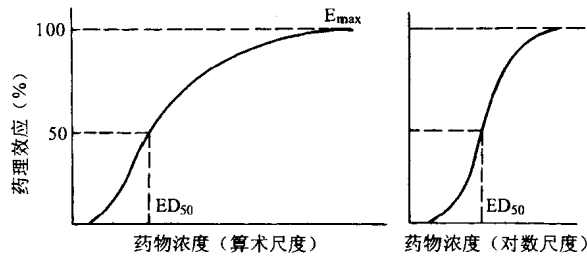


图 2-1 量反应的量效关系曲线

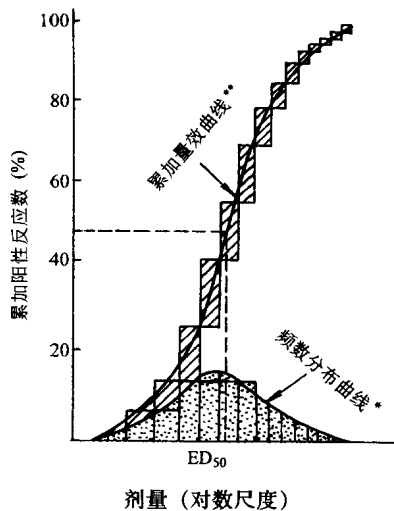


图 2-2 质反应的频数分布曲线和累加量效曲线

\* 频数分布曲线: 100 个人的有限剂量分布情况 (常态分布);

\*\* 累加量效曲线: 频数分布曲线中每个长方形的累加曲线

上述两种曲线有下列几个特点:

(1) 将剂量从小到大逐渐增加,直到效应开始出现,此时的剂量称为阈剂量 (threshold dose) 或最小有效量 (minimum effective dose) (如果横坐标用浓度表示,将剂量改为浓度即可,下同)。

(2) 半数有效量是能引起 50% 阳性反应 (质反应) 或 50% 最大效应 (量反应) 的浓度或剂量,分别用半数有效浓度 ( $EC_{50}$ ) 或半数有效剂量 ( $ED_{50}$ ) 表示。如果效应指标为中毒或死亡则可改用半数中毒浓度 ( $TC_{50}$ )、半数中毒剂量 ( $TD_{50}$ ) 或半数致死浓度 ( $LC_{50}$ )、半数致死剂量 ( $LD_{50}$ ) 表示。