



全国医药卫生类农村医学专业教材

# 药理学

主 编 崔玉国 符秀华



第四军医大学出版社

全国医药卫生类农村医学专业教材

# 药 理 学

主 编 崔玉国 符秀华

副主编 杨立新 章 龙 田小娟 辛雅菊

编 者 (以姓氏笔画为序)

乌兰巴依尔 (巴音郭楞蒙古自治州卫生学校)

田小娟 (长沙卫生职业学院)

闫丽珍 (巴音郭楞蒙古自治州卫生学校)

杨立新 (内蒙古赤峰学院)

辛雅菊 (临夏回族自治州卫生学校)

张石在 (内蒙古鄂尔多斯市卫生学校)

徐 新 (内蒙古赤峰学院附属医院)

崔玉国 (内蒙古赤峰卫生学校)

符秀华 (安徽省淮南卫生学校)

章 龙 (福建省龙岩卫生学校)

谢廷良 (福建省福清卫生学校)

第四军医大学出版社·西安

## 图书在版编目(CIP)数据

药理学/崔玉国,符秀华主编. —西安:第四军医大学出版社,2012.4

全国医药卫生类农村医学专业教材

ISBN 978 - 7 - 5662 - 0143 - 0

I. ①药… II. ①崔… ②符… III. ①药理学 - 医学院校 - 教材 IV. ①R96

中国版本图书馆CIP数据核字(2012)第063466号

## 药理学

- 主 编 崔玉国 符秀华  
责任编辑 马元怡 王 娥  
出版发行 第四军医大学出版社  
地 址 西安市长乐西路17号(邮编:710032)  
电 话 029 - 84776765  
传 真 029 - 84776764  
网 址 <http://press.fmmu.sn.cn>  
印 刷 陕西奇彩印务有限责任公司  
版 次 2012年5月第1版 2012年5月第1次印刷  
开 本 787×1092 1/16  
印 张 17  
字 数 420千字  
书 号 ISBN 978 - 7 - 5662 - 0143 - 0/R·1009  
定 价 39.00元

版权所有 侵权必究

购买本社图书,凡有缺、倒、脱页者,本社负责调换

# 全国医药卫生类农村医学专业教材 建设委员会

主任委员 刘 晨

副主任委员 赵昌伦 宾映初 曹文元 朱爱军

委 员 (按姓氏笔画排序)

马永林 邓鼎森 石海兰 刘 敏

苏传怀 杨海根 吴 明 吴 敏

何海明 宋立富 张 展 张来平

张金来 张惊湖 陈德军 邵兴明

金 花 胡月琴 格根图雅 郭尧允

菅辉勇 崔玉国 符史干

# 出版说明

2010年教育部颁布《中等职业学校专业目录》(2010修订版),新增农村医学专业,以承担为农村医疗单位培养合格医务人员的责任,但教学实施过程中缺乏一套实用、适用的教材。为此,第四军医大学出版社联合中国职教学会教学工作委员会、中华预防医学会职业教育分会,按照研究先行、实践支撑的科学原则,完成农村医学专业课程的研究工作,其后组织全国40余所职业院校于2011年7月正式启动国内首套“全国医药卫生类农村医学专业教材”的编写工作。

本套教材的编写思想强调两个“转变”、三个“贴近”,即由传统的“以学科体系为引领”向“以解决基层岗位实际问题为引领”的转变,由“以学科知识为主线”向“基层实际应用技能为主线”转变;坚持“贴近学生、贴近岗位、贴近社会”,最终构建集思想性、科学性、先进性、启发性和适用性相结合的农村医学专业教材体系。同时,为满足农医专业学生参加临床执业助理医师资格考试的需求,教材设计了“案例分析”和“考点链接”模块,通过选编临床典型案例和高频考点并进行解析,以加深学生对重点、考点内容的理解,并提高其实际应用能力。

全套教材包括公共基础课、专业基础课、专业课、选修课、毕业实习与技能实习5个模块,共31门课程,主要供农村医学专业及其他医学相关专业使用,亦可作为基层医务人员的培训教材。

# 序

太湖之滨，烟波浩渺，鱼米之乡，“二泉映月”委婉、舒缓、宁静、快乐、执着、激昂，感悟历史沧桑与幸福向往，名曲中外扬。十年前的昨天，来自全国的医学教育精英在此共议大事，筹划“卫生保健”专业的建设；十年后的今天，群英再聚首，同商“农医”专业的开拓发展，我们为之喝彩鼓掌。

农村，有着我国最广大的人口群体，“新农合”惠民政策正在深入人心，为百姓交口称道。为百姓的健康，培养身边下得来、留得住、干得好的农村医生，中国预防医学会公共卫生职教分会担重担、勇创新，组织全国开设此专业的院校齐心协力、智慧汇聚，使“农医”专业的建设应时而生、应势而长，使国家的惠民大计落地、生根、开花，将结出丰硕果实。这炫丽的花朵，恰绿叶相托，第四军医大学出版社捧上一片事业爱心、待人诚心，尽全力支持本专业的研究、开发和教材建设，并已见成效。

本套教材是教育部2010年确定开设“农医”专业后的第一套教材，有着很大的创新要求。它依据教育部专业目录与专业简介（2010版），以及此基础上公卫职教分会的研究结果——教改性教学方案而编写；它将医学教育与职业教育相结合，满足岗位需要；它适合学生、教师、院校的实际情况，具有可操作性。为此，陈锦治理事长、学会的核心院校领导和老师们共同努力，第四军医大学出版社鼎力支持，分析了本专业的教育目标、教育层次、岗位特征、学制学时、教学特点、学生状况以及执业资格准入标准等多个因素，提出了初中毕业起点学生获得农村医生执业（助理执业医师标准以上）能力的课程结构与基本教学内容。相信在教学实践中，老师们将结合实际做出进一步地探索与发展，以培养出合格的新型农村医生，发展医学服务事业，造福百姓，完成社会、时代所赋予的重任。

“农医”专业的课程与教材建设宛如柔韧多彩的江南乐曲与质朴高亢的秦腔汇成的一个春天的曲目，它会得到全国不同地区院校师生们的喜爱与爱护，它将是大家共同创造的“农医”专业的美好明天。

刘 晨

2012年3月28日于北京

# 前 言

农村医学专业是中职新增设的专业，主要目的是解决农村地区卫生技术人员不足的问题，培养的人才主要是服务农村基层，为村卫生室及边远贫困地区乡镇卫生院培养“留得住”“用得上”的实用型人才。但在教学实施过程中，缺乏一套实用、适用的专业教材。为此，中华预防医学会职业教育分会与第四军医大学出版社经过认真遴选，组织全国40余所职业院校老师参与编写农村医学专业教材。

《药理学》为本套教材基础科目之一，与医学基础学科和临床学科的关系密切。教材编写时注重加强基础学科和临床学科的联系，使相关学科融为一个有机的整体。教材大纲依据《医师资格考试大纲——临床执业助理医师》制定，结合临床执业助理医师资格考试题型，突出本章节重点、难点内容，帮助学生提高学习效率，加深重点内容记忆，提高临床执业助理医师资格考试通过率。编写中依据“实用为本，够用为度”的原则，减少了药物的体内作用过程和一些抽象繁杂、枯燥的药理作用机制的内容，主要突出药物的作用、临床应用及不良反应和药物的用法和用量。为使学生明确学习的重点、难点，做到学习有目的，针对学习要点给出综合测试题附于每章后面，便于巩固所学知识，增强综合运用能力。

教材分两部分，第一部分共十七章，介绍了各系统常见药物的药理作用、临床应用、不良反应等内容。考虑到目前临床新药品增加很快，为了让学生毕业后尽快适应临床工作，适当增加新药知识介绍。第二部分为药理实践技能培训，介绍了常用的二十项实验操作。

教材适用于农村医学专业使用，也可作为乡村医师以及相关培训用书。本书中所列举的药物剂量供读者参考，在临床应用时请遵照医嘱。

在教材编写过程中，第四军医大学出版社及编者所在单位都给予了大力支持，在此一并表示衷心的感谢。

由于水平有限，缺点错误在所难免，恳请指正。

崔玉国

2012年3月

# 目 录

<b>第一章 总论</b> .....	( 1 )
第一节 绪言 .....	( 1 )
第二节 药物效应动力学 .....	( 2 )
第三节 药物代谢动力学 .....	( 7 )
第四节 影响药物作用的因素 .....	( 11 )
<b>第二章 传出神经系统药</b> .....	( 14 )
第一节 概述 .....	( 14 )
第二节 拟胆碱药 .....	( 18 )
第三节 抗胆碱药 .....	( 22 )
第四节 拟肾上腺素 .....	( 25 )
第五节 抗肾上腺素药 .....	( 30 )
<b>第三章 局部麻醉药</b> .....	( 36 )
<b>第四章 中枢神经系统药</b> .....	( 40 )
第一节 镇静催眠药 .....	( 40 )
第二节 抗癫痫药和抗惊厥药 .....	( 42 )
第三节 抗精神失常药 .....	( 44 )
第四节 帕金森病药 .....	( 48 )
第五节 镇痛药 .....	( 50 )
第六节 解热镇痛抗炎药 .....	( 53 )
<b>第五章 心血管系统药</b> .....	( 60 )
第一节 抗高血压药 .....	( 60 )
第二节 抗心绞痛药 .....	( 65 )
第三节 调血脂药 .....	( 68 )
第四节 抗心律失常药 .....	( 70 )
第五节 抗慢性心功能不全药 .....	( 75 )
<b>第六章 利尿药与脱水药</b> .....	( 85 )
第一节 利尿药 .....	( 85 )
第二节 脱水药 .....	( 89 )





<b>第七章 抗过敏药</b> .....	( 93 )
第一节 抗组胺药 .....	( 93 )
第二节 钙剂 .....	( 95 )
<b>第八章 作用于呼吸系统药</b> .....	( 97 )
第一节 平喘药 .....	( 97 )
第二节 镇咳药 .....	( 102 )
第三节 祛痰药 .....	( 104 )
<b>第九章 作用于消化系统药</b> .....	( 108 )
第一节 抗消化性溃疡药 .....	( 108 )
第二节 助消化药 .....	( 112 )
第三节 止吐及胃肠动力药 .....	( 113 )
第四节 泻药 .....	( 114 )
第五节 止泻药 .....	( 116 )
第六节 利胆药 .....	( 116 )
<b>第十章 子宫兴奋药</b> .....	( 120 )
<b>第十一章 作用于血液及造血系统的药物</b> .....	( 123 )
第一节 抗贫血药 .....	( 123 )
第二节 促凝血药、抗凝血药和溶栓药 .....	( 126 )
第三节 血容量扩充药 .....	( 132 )
<b>第十二章 激素类药物</b> .....	( 138 )
第一节 肾上腺皮质激素 .....	( 138 )
第二节 胰岛素和口服降血糖药 .....	( 142 )
第三节 甲状腺激素类药和抗甲状腺药 .....	( 144 )
<b>第十三章 维生素类药</b> .....	( 150 )
第一节 水溶性维生素 .....	( 150 )
第二节 脂溶性维生素 .....	( 152 )
<b>第十四章 抗微生物药</b> .....	( 155 )
第一节 概述 .....	( 155 )
第二节 抗生素 .....	( 156 )
第三节 人工合成抗菌药 .....	( 169 )
第四节 抗结核病药 .....	( 174 )
第五节 抗真菌药和抗病毒药 .....	( 177 )
第六节 消毒防腐剂 .....	( 181 )

<b>第十五章 抗寄生虫病药</b> .....	(187)
第一节 抗疟药 .....	(187)
第二节 抗阿米巴病药及抗滴虫病药 .....	(191)
第三节 抗血吸虫病药和丝虫病药 .....	(193)
第四节 抗肠蠕虫药 .....	(194)
<b>第十六章 抗恶性肿瘤药物</b> .....	(198)
第一节 概述 .....	(198)
第二节 常用抗肿瘤药物 .....	(200)
<b>第十七章 解毒药</b> .....	(210)
第一节 金属和类金属中毒解毒药 .....	(210)
第二节 氰化物中毒解毒药 .....	(211)
第三节 有机氟中毒解毒药 .....	(212)
<b>处方分析</b> .....	(216)
<b>实验指导</b> .....	(222)
实验一 药物剂量对药物作用的影响 .....	(222)
实验二 不同给药途径对药物作用的影响 .....	(222)
实验三 传出神经系统药物对离体肠平滑肌作用的影响 .....	(223)
实验四 去甲肾上腺素的缩血管作用 .....	(224)
实验五 传出神经药对动物血压的影响 .....	(224)
实验六 有机磷酸酯类中毒及其解救 .....	(226)
实验七 普鲁卡因的传导麻醉作用 .....	(226)
实验八 苯巴比妥的镇静催眠作用 .....	(227)
实验九 地西洋的抗惊厥作用 .....	(228)
实验十 氯丙嗪的镇静和降温作用 .....	(228)
实验十一 镇痛药的镇痛作用 .....	(229)
实验十二 临床病例用药分析 .....	(230)
实验十三 强心苷的强心作用 .....	(231)
实验十四 临床病例用药讨论 .....	(232)
实验十五 影响尿生成的因素及利尿药的作用 .....	(233)
实验十六 可待因的镇咳作用 .....	(234)
实验十七 硫酸镁的导泻作用 .....	(235)
实验十八 激素类药物的作用 .....	(236)
实验十九 链霉素急性中毒及解救 .....	(237)
实验二十 青霉素类过敏性休克的抢救及讨论 .....	(238)
<b>模拟测试卷</b> .....	(239)



参考答案..... (256)

参考文献..... (259)

# 第一章 总论

## 第一节 绪言

### 一、药理学的概念

药物是指可以改善或查明机体的生理功能及病理状态，可用于预防、治疗和诊断疾病或用于计划生育的化学物质。药物与毒物之间没有严格的界限，用药不当可对机体造成危害，甚至引起毒性反应，危及生命。

药理学是研究药物与机体（包括病原体）相互作用规律及其机制的学科，它既研究药物对机体的作用及其机制，即药物效应动力学，又称药效学；也研究药物在机体的影响下所发生的变化及其规律，即药物代谢动力学，又称药动学。

药理学以生理学、生物化学、病理学、病理生理学、微生物学、免疫学、分子生物学等为基础，研究药物的作用及作用机制，为临床合理用药、发挥药物最佳疗效、防治不良反应提供理论依据。因此，它是连接基础医学和临床医学、医学和药学的桥梁和纽带。

### 二、药理学的发展简史

#### （一）古代药理学的发展

古代，人们在长期的生活实践中逐渐认识到一些天然物质的治疗作用，如大黄导泻、饮酒止痛、柳树皮退热等，随着这些实践经验的积累和新的药物品种的不断发现，经过总结，专门记载药物知识的书籍就在民间流传了。我国最早的一部药物专著《神农本草经》大约出现在公元一世纪前后，全书收载药物 365 种，其中不少药物沿用至今。唐代出版的《新修本草》是我国第一部官府颁发的药典，收载药物 884 种。明朝医药学家李时珍著成了闻名世界的药物学巨著《本草纲目》，全书收载药物 1892 种，方剂 11 000 余条，附插图 1160 幅，共 52 卷，190 万字。这本巨著已有英、日、朝、德、法、俄及拉丁七种文字的译本，在世界范围内广为流传，至今仍是重要的药物学文献之一。此外，埃及的《埃泊斯医药集》、希腊医生狄奥斯库莱底斯编著的《古代药物学》和罗马医生盖林编著的《药物学》等都在药理学的发展中作出巨大贡献。

#### （二）近代药理学的发展

18 世纪，生理学和生物化学的发展为药理学奠定了基础。药理学成为一门独立的学科是从德国的 R. Buchheim 开始的，他建立了世界上第一个药理学实验室，写成了第一



本药理学教科书。他的学生发展了实验药理学，研究药物的作用部位，开创了器官药理学。19 世纪初叶，有机化学的开展为药理学提供了物质基础，人们不断从有治疗作用的植物中提取出活性成分，得到纯度较高的药物，如吗啡、奎宁，阿托品等。从有机砷化合物中提取出新凡纳明治疗梅毒，开创了化学药物的新纪元。1940 年，青霉素的发现，标志着以抗生素为代表的化学治疗药物时代的来临。

### （三）现代药理学的发展

20 世纪，许多药理学分支出现，如分子药理学、生化药理学、遗传药理学、时间药理学等。特别是分子生物学的迅猛发展使药物发展进入了生物药物阶段。利用分子生物学的理论和研究方法，药理学在深入研究和认识生命现象的本质及其与药物和生物大分子之间的相互作用等方面得到了发展。

## 三、学习药理学的目的和方法

### （一）药理学学习目的

1. 做到合理用药，使临床用药安全有效。重点掌握药物的药理作用和临床用途，以及不良反应。
2. 为今后学习新药知识打下基础，以适应药理学知识不断更新及新药不断涌现发展趋势。

### （二）药理学学习方法

1. 密切联系其他基础医学学科 注意药理学与其他基础医学学科的联系，从而对药物的作用和作用机制加深了解。
2. 注意药物的双重性 药物对机体既有有利的一面，也有有害的一面。因此，必须全面地掌握药物的治疗作用和不良反应，力求安全、有效的使用药物。
3. 理论学习和实验相结合 药理学是一门实验科学，通过实验，一方面可以使一些概念、规律和结论更加形象化，另一方面还可提高观察、分析、解决问题的能力。
4. 加强理解药理学的内在联系 注意掌握具有代表性的重点药，在此基础上，通过比较重点药和非重点药的异同，了解或熟悉非重点药的主要特点。

## 第二节 药物效应动力学

### 一、药物作用与效应

药物作用是药物与机体之间的初始作用，是动因。有其特异性。药理效应是机体对药物的反应，是结果。作用与效应意义相近，通常二者通用。

药物作用是通过改变机体的生理、生化功能而产生的，表现为原有功能的加强和减弱，前者称为兴奋，后者称为抑制。药理效应可以是药物直接对它所接触的器官、细胞产生作用，也可以通过机体反射机制或生理性调节间接产生。例如，去甲肾上腺素可以直接作用于血管上的  $\alpha$  肾上腺素能受体，使血管收缩、血压升高，同时可通过机体的血压反射机制使心率减慢。

药理效应的专一性称为选择性。药物引起机体产生效应的范围与其选择性有关，选择性强的药物作用范围窄，选择性不强的药物作用范围广。例如，青霉素抑制革兰阳性菌细胞壁的合成，杀灭敏感菌的作用有很强的选择性，属窄谱抗生素。同一种药物在发挥作用的不同水平或环节其药理作用的选择性可能有很大差异。例如，阿托品特异性的阻断 M - 胆碱受体，但其药理效应选择性并不高，对心脏、血管、平滑肌、腺体及中枢神经系统都有影响，而且有的兴奋、有的抑制。一般来说，选择性强的药物临床应用时针对性强，不良反应少。但增加剂量时，往往会因生理性反射、生化反应失去平衡等机制使药理效应变得广泛。

## 二、药物作用的主要类型

### （一）局部作用与吸收作用

药物在用药局部接触机体的部位所产生的作用称为局部作用。吸收作用又称为全身作用，是指药物吸收入血之后分布到组织、器官所呈现的作用，如对乙酰氨基酚的解热镇痛作用，氢氯噻嗪的利尿作用等。

### （二）选择性作用与非选择性作用

有些药物吸收后，对机体的器官或系统所产生的作用有明显的选择性，称为选择性作用。例如，呋塞米选择性作用于肾脏产生利尿作用。药物的选择性作用是相对的，这与用药剂量有关。有些药物小剂量时只作用于某一组织器官，大剂量时则引起较广泛的全身作用。例如巴比妥类药物在小剂量时有中枢抑制作用，随着剂量的增加，其中枢抑制作用由弱到强，大剂量则对心血管系统表现明显抑制作用，过量可致呼吸中枢麻痹。

另有一些药物对许多器官或系统都可产生作用，称为非选择性作用。例如，阿托品可作用于消化道、汗腺、眼、呼吸道、心血管系统等多种器官发挥作用。

### （三）治疗作用与不良反应

1. 治疗作用 药物所产生的，符合临床用药目的的作用。根据治疗作用的效果可分为：①对因治疗，指针对病因的治疗（治本），例如应用抗生素类杀灭或抑制致病原微生物，应用解毒药促进体内毒物消除等。②对症治疗，指改善症状的治疗（治标），例如高热时应用解热镇痛药阿司匹林，降低体温解除发热给患者带来的痛苦。有时对症治疗对维持重要生命指标，赢得对因治疗的时机非常重要，例如对休克、心力衰竭、脑水肿、惊厥等临床急症分秒必争地进行抢救多属对症治疗。③补充疗法，又称替代疗法，可纠正发病原因并改善症状。但补充疗法并非针对原发病灶，亦不直接针对症状，与对因治疗和对症治疗均有区别。

2. 不良反应 药物所引起的不符合用药目的，并给患者带来痛苦或危害的反应称为不良反应。药物与毒物之间是没有明显界限的，因此药物的治疗作用和不良反应是其本身固有的两重性作用。药物的不良反应主要有以下几类：

（1）副作用 是非治疗目的的药理效应。指药物在治疗剂量时引起的，与治疗目的无关的作用，给患者带来轻微的不适或痛苦，多半是可以恢复的功能性变化。副作用是药物本身所固有的作用。产生副作用的原因是药物选择性作用差，作用所涉及的范围广泛。当其某一效应被用作治疗目的时，其他效应就成了副作用。副作用一般是可预料并



可以避免或减轻的，例如麻黄碱在解除支气管哮喘时，也兴奋中枢神经系统，引起失眠，同时给予镇静药可对抗其中枢兴奋作用。

### 考点链接

下述哪种剂量时产生的不良反应是副作用

- A. 中毒量    B. 无效量    C. 极量    D. 半数致死量    E. 治疗量

解析：副作用是在治疗剂量时出现的与治疗目的无关的作用。参考答案：E。

(2) 毒性反应 一般是用量过大或用药时间过长，药物在体内蓄积过多引起的严重不良反应。有时用药量不大，但机体对药物过于敏感也能出现毒性反应。绝大多数药物都有一定的毒性，例如治疗慢性心功能不全的药物地高辛过量可引起心律失常等。短期内过量用药引起的毒性称急性毒性，多损害循环、呼吸及神经系统功能。长期用药时由于药物在体内蓄积而逐渐发生的毒性称为慢性毒性，常损害肝、肾、造血器官及内分泌等器官的功能。药物的三致（致癌、致畸胎、致突变）作用属于慢性毒性中的特殊毒性。

(3) 后遗效应 是指停药后血浆药物浓度下降至阈浓度以下时残存的药理效应。例如服用巴比妥类催眠药后，次晨仍有困倦现象；长期应用肾上腺皮质激素后肾上腺皮质功能低下，数月内难以恢复等。注意区分副作用与后遗效应：两者浓度不同，作用性质不同。

(4) 变态反应 是药物引起的免疫反应，包括免疫学中的各种免疫反应，反应性质与药物原有效应无关。

(5) 停药反应 是指突然停药后原有疾病的加重，也称反跳。如长期服用可乐定停药次日血压即急剧升高。

(6) 特异质反应 某些药物可以使少数患者出现特异性的不良反应，反应性质可能与常人不同。特异质患者对某种药物反应异常增高。例如遗传性（葡萄糖-6-磷酸脱氢酶）G-6-PD 缺乏者服用磺胺后可致溶血。

影响药物不良反应发生的原因：机体的生理病理状况、性别、年龄、遗传因素、用药剂量、用药时间等许多因素。此外，药物相互作用、环境因素以及机体自身内环境的稳定情况均可影响不良反应的发生。例如，头孢菌素类能增强氨基糖苷类的肾毒性。

### 三、药物剂量 - 效应关系

1. 量 - 效关系 药理效应与剂量在一定范围内成比例，这就是剂量 - 效应关系（简称量 - 效关系）。用效应强度为纵坐标、药物剂量或药物浓度为横坐标作图则得量 - 效曲线（图 1-1）。

2. 量 - 效曲线的意义

(1) 量 - 效曲线表明，剂量大小是药物效应强弱的决定因素之一，按药物效应强度

由小到大依次分为：①无效量，即在体内不能引起明显药理作用的量。②最小有效量，是指引起效应的最小药量或最低药物浓度。③治疗量，是指最小有效量和极量之间的量，对机体发生治疗作用。④极量，又称最大治疗量，即出现最大的治疗作用，但尚未引起毒性反应的量。⑤中毒量，即引起毒性反应的量。⑥致死量，是指引起死亡的量。

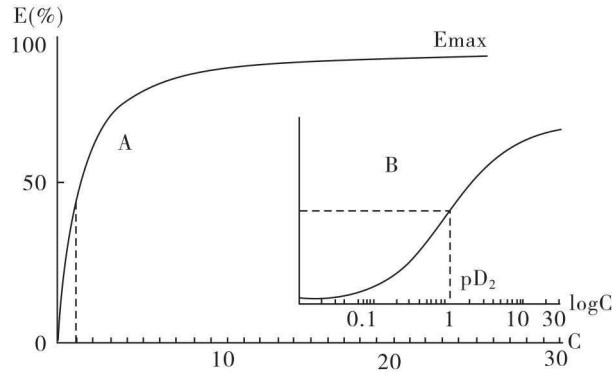


图 1-1 药物作用的量 - 效关系曲线

(2) 比较药物的效能 效能是指在一定范围内增加药物剂量或浓度，效应强度随之增加。但当效应增强到最大时，继续增加剂量或浓度，效应不再增强。这一药理效应的极限称为最大效应或效能，它反映了药物内在活性的大小，如强效利尿药呋塞米的效能大于中效利尿药氢氯噻嗪。

(3) 药物的效价强度 用于作用性质相同的药物之间的等效剂量的比较，达到等效时所用剂量较小者效价强度大，所用剂量大者效价强度小。

(4) 反应药物效应和毒性 指测定能引起 50% 最大反应强度的药量，称为半数有效量 ( $ED_{50}$ )，它可反映治疗效应。如效应为死亡，则称为半数致死量 ( $LD_{50}$ )，反应药物的毒理效应。

(5) 评价药物安全性 目前评价药物安全性的指标主要有两个：①治疗指数，是半数致死量与半数有效量的比值 ( $LD_{50}/ED_{50}$ )。此值越大，药物的安全性越大。②安全范围，是指最小有效量和最小中毒量之间的范围。此范围愈大，用药愈安全。反之，此范围愈小，用药愈不安全。

#### 四、药物作用的机制

药物作用机制是研究药物如何与机体细胞结合而发挥作用的问题。药物作用机制多样，主要表现为以下几个方面：

1. 酶的影响 酶是由机体细胞产生的具有催化作用的蛋白质，能促进各种细胞成分的代谢。有些药物以酶为作用靶点，对酶产生激活、诱导、抑制或复活作用。例如，苯巴比妥可使肝微粒体酶的活性增强、含量增加，而加速对某些药物的生物转化。如奥美拉唑通过抑制胃黏膜的  $H^+ - K^+ - ATP$  酶，发挥抑制胃酸分泌的作用。有些药物本身就是酶，例如胃蛋白酶、胰蛋白酶。还有些药物本身是酶的底物经转化后发挥作用，例如左旋多巴通过血脑屏障后，被纹状体中多巴脱羧酶代谢为多巴胺，发挥补充中枢递质的





作用。

2. 作用于离子通道 离子通道能调节细胞膜内外无机离子的分布,如  $\text{Ca}^{2+}$ 、 $\text{K}^{+}$ 、 $\text{Na}^{+}$  及  $\text{Cl}^{-}$  可通过细胞膜上的离子通道进行跨膜转运。有些药物可直接作用于细胞膜上的离子通道而发挥作用,如利多卡因通过轻度阻滞钠通道,发挥降低心肌自律性的作用。

3. 影响核酸代谢 许多药物直接影响核酸代谢而发挥药理效应,例如磺胺类抗菌药通过抑制细菌体内叶酸的代谢而干扰核酸的合成。

4. 作用于载体 有些药物可通过对某种载体的抑制产生效应,例如利尿药呋塞米通过抑制肾小管对钠、钾、氯离子的重吸收而发挥利尿作用。

5. 影响免疫功能 有些药物通过增强或抑制机体的免疫功能而发挥作用。如糖皮质激素类药能抑制机体的免疫功能,可用于防止器官移植时的免疫排斥反应。免疫增强药多作为辅助治疗药物用于免疫缺陷疾病如艾滋病、慢性感染及恶性肿瘤等。

### 6. 与受体结合

(1) 受体的概念 受体是对生物活性物质具有识别能力并可与之选择性结合的生物大分子。多数受体存在于细胞膜上,并镶嵌在双层脂质的膜结构中(胞膜受体),少数受体存在于细胞内(胞浆受体)。与受体特异性结合的生物活性物质称为配体,受体都有内源性配体。配体与受体大分子中的一小部分结合,该结合部位叫做结合位点或受点。受体具有如下特性:①灵敏性,受体只需与很低浓度的配体结合就能产生显著的效应;②特异性,引起某一类型受体兴奋反应的配体的化学结构非常相似,不同光学异构体的反应可以完全不同,同一类型的激动药与同一类型的受体结合时产生的效应类似;③饱和性,受体数目是一定的,因此配体与受体结合的剂量反应曲线具有饱和性,作用于同一受体的配体之间存在竞争现象;④可逆性,配体与受体既可结合,又可解离,解离后的配体性质没有改变;⑤多样性,同一受体可广泛分布到不同的细胞而产生不同效应。

(2) 药物与受体结合 药物与受体结合引起生物效应尚需具备两个条件,即亲和力和内在活性。亲和力是指药物与受体结合能力的大小。内在活性指药物与受体结合时激动受体的能力。根据药物具有亲和力和内在活性的情况,把药物分为三类。药物对受体既有亲和力,又具有内在活性者称为受体激动药。药物对受体只有亲和力,而无内在活性者称为受体阻断药或拮抗药。药物对受体有较大的亲和力和较弱的内在活性,可与大量受体结合,只能引起较弱的生理效应,称为部分激动药。

(3) 药物与受体相互作用 药物与受体结合,产生药理作用。药物与受体结合发挥作用具有高度特异性、高度敏感性、饱和性以及可逆性的特点。高度特异性指药物能准确识别并结合与其相适应的受体,并产生特定的生理效应。高度敏感性指由于受体分子只占细胞微小的部分,而药物—受体复合物能够激活一系列生物放大效应,使用微量的药物,就能引起高度生理活性。而饱和性是指由于受体数目有限,故药物与受体结合有饱和性。可逆性是指药物与受体的结合和分离处于动态平衡状态,与受体分离后的形式仍然是药物的原形,而不是代谢物。

(4) 受体的调节 药物可影响受体反应性的高低。通常当激动药浓度过高或长期激动受体时,受体数目会减少,称为向下调节。反之,长期应用阻断药或内源性激动剂浓度低于正常时,受体数目会增加,称为向上调节。向下调节与机体对长期应用激动剂后