

Quanguo Zhongdeng Weisheng
Zhiye Jiaoyu Jiaocai

全国中等卫生职业教育教材

药 物 学

Yaowuxue

主编 陈小茜



广东科技出版社

图书在版编目 (CIP) 数据

药理学/陈小茜主编. —广州: 广东科技出版社,
2006.3
ISBN 7-5359-3914-7

I. 药… II. 陈… III. 药理学—专业学校—教材
IV. R9

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2005) 第 158083 号

出版发行: 广东科技出版社

(广州市环市东路水荫路 11 号 邮码: 510075)

E - mail: gdkjzbb@21cn.com

http: //www.gdstp.com.cn

经 销: 广东新华发行集团股份有限公司

印 刷: 广东省肇庆新华印刷有限公司

(广东省肇庆市星湖大道 邮码: 526060)

规 格: 787mm × 1 092mm 1/16 印张 15.75 字数 340 千

版 次: 2006 年 3 月第 1 版

2006 年 3 月第 1 次印刷

印 数: 1 ~ 4 000 册

定 价: 26.00 元

如发现因印装质量问题影响阅读, 请与承印厂联系调换。

前 言

在充分认识加快发展职业教育的重要意义基础上,本着以高度的责任感和紧迫感,学习、贯彻好全国职业教育工作会议精神和《国务院关于大力发展职业教育的决定》,努力实现我国职业教育发展和改革的新跨越,我们对卫生部教材办公室统一组编的1997年第一版《药理学》规划教材进行了改编。该书主要供全国中等卫生学校护理、助产、卫生保健等专业使用。

本书从更好地推行现代医学教育模式,适应“以人的健康为中心”,培养实用性人才的目标出发,根据护理专业对药物知识和技能的特定要求进行改编。编写内容凸显了整体护理中的“用药监测”和“用药护理”。在编写过程中,注意体现了药物基本知识、基本理论、基本技能的三基性;同时更体现了教材的思想性、科学性、先进性、启发性和适用性。

本教材注意涵盖了如下内容:

1. 结合临床增加或删改了部分章节,如增加了全身麻醉药,尤其是该章节的“用药监测”和“用药护理”方面,对外科麻醉术后患者的护理提供帮助。此外,还补充了抗艾滋病药物等内容。
2. 调整了一些章节编排。鉴于近年利尿药在心血管疾病治疗中占有越来越重要的地位,将利尿药一章调至治疗心血管疾病药物之前,有利于同学们学习。
3. 为适应护理专业英语向专业化方向的发展,所有专有名词和概念术语都标上英语。
4. 本书的药物,主要遴选自卫生部最新颁布的国家基本药物名单,及临床疗效确切的新特药物,并参考了《中华人民共和国药典》(2000版)等有关参考文献。

第二版在修订过程中,得到了原第一版的广东科技出版社医药卫生编辑室郭飞主任与丁嘉凌编辑的帮助与支持,对本版修订给予耐心细致的修审,并提出了宝贵的建议,对此全体参编者表示敬意和谢意。

本书能如期编辑出版得到了各编者单位的大力支持,各编者认真负责,广东省广州医学院护理学院陈沁副院长亲临指导,药理教研室王桂平、邓敏、韦敏等副教授、讲师,做了大量的工作,尤其是河北邢台医学高等专科学校陈晶、魏国会副教授,广东省珠海市卫生学校王慧芝、刘跃进高级讲师,广东省化工制药职业技术学院孙师家高级讲师做了许多编写、编务和协助工作,在此,一并致谢。

恳请各位读者提出宝贵意见。

陈小茜 陈 沁

2006年1月

目 录

第一章 总论	1
第一节 绪言	1
一、药物和药物学的概念	1
二、药物学的学习目的和方法	1
第二节 药物对机体的作用——药效学	2
一、药物作用与药物效应	2
二、治疗效果与不良反应	2
三、药物的作用机制	4
第三节 机体对药物的影响——药动学	5
一、吸收	5
二、分布	7
三、代谢	8
四、排泄	9
五、药物的消除与蓄积	10
第四节 影响药物效应的因素	11
一、药物因素	12
二、机体因素	14
第五节 药物学在护理用药中的作用	15
一、在药物治疗中的作用	16
二、在用药咨询中的作用	17
三、护理用药中护理程序的运用	18
第二章 作用于传出神经系统药	20
第一节 概述	20
一、传出神经的化学传递和递质	20
二、传出神经按递质分类	20
三、传出神经受体的种类、分布和效应	20
四、传出神经递质的合成与转归	22
五、传出神经系统药物的基本作用及分类	23
第二节 胆碱受体激动药	24
一、M受体激动药	24
二、胆碱酯酶抑制药	25
三、用药监护	27
第三节 胆碱受体阻断药	27

一、M受体阻断药	27
二、胆碱酯酶复活药	28
三、用药监护	29
第四节 肾上腺素受体激动药	30
一、 α 受体激动药	30
二、 α 、 β 受体激动药	31
三、 β 受体激动药	32
四、用药监护	33
第五节 肾上腺素受体阻断药	34
一、 α 受体阻断药	34
二、 β 受体阻断药	35
三、用药监护	35
第三章 麻醉药	38
第一节 全身麻醉药	38
一、吸入麻醉药	38
二、静脉麻醉药	38
三、复合麻醉	39
四、全麻药主要不良反应	39
五、用药监护	40
第二节 局部麻醉药	41
一、局麻药的作用	41
二、局部麻醉方法	41
三、常用局麻药	42
四、用药监护	43
第四章 镇静催眠药	44
第一节 苯二氮革类	44
第二节 巴比妥类	45
第三节 其他镇静催眠药	46
第四节 镇静催眠药的用药监护	47
第五章 抗癫痫药	49
第一节 癫痫的临床类型	49
第二节 常用抗癫痫药物	49
第三节 抗癫痫药的临床用药原则	50
第四节 抗癫痫药的用药监护	51
第六章 抗精神失常药	52
第一节 抗精神病药	52
一、吩噻嗪类	52
二、其他抗精神病药	54

第二节 抗躁狂药与抗抑郁药	54
一、抗躁狂药	55
二、抗抑郁药	55
第三节 抗焦虑药	55
第四节 抗精神失常药的用药监护	56
第七章 麻醉性镇痛药	57
第一节 阿片生物碱类镇痛药	57
第二节 人工合成镇痛药	58
第三节 麻醉性镇痛药的用药监护	59
附：阿片受体拮抗剂	59
第八章 解热镇痛抗炎药	61
第一节 概述	61
一、解热作用	61
二、镇痛作用	61
三、抗炎抗风湿作用	61
第二节 常用的解热镇痛抗炎药	62
一、水杨酸类	62
二、其他类	62
第三节 解热镇痛抗炎药的用药监护	63
附：癌症病人三级止痛阶梯治疗	63
第九章 中枢兴奋药	65
第一节 主要兴奋大脑皮层的药物	65
第二节 主要兴奋呼吸中枢的药物	66
第三节 促大脑功能恢复药	66
第四节 中枢兴奋药的用药监护	67
第十章 抗过敏药	68
第一节 组胺及组胺受体阻断药	68
一、H ₁ 受体阻断药	69
二、H ₂ 受体阻断药	70
三、用药监护	71
第二节 钙剂	71
一、常用药物	71
二、用药监护	72
第十一章 作用于消化系统药物	73
第一节 助消化药	73
第二节 抗消化性溃疡药	73
一、抗酸药	74
二、胃酸分泌抑制药	74

三、黏膜保护药	75
四、抗幽门螺杆菌药	75
五、用药监护	76
第三节 泻药与止泻药	76
一、泻药	76
二、止泻药	78
三、用药监护	78
第四节 镇吐药	79
一、5-羟色胺受体阻断药	79
二、多巴胺受体阻断药	79
第五节 胃、肠动力调节药	80
一、胃、肠动力药	80
二、胃、肠解痉药	80
第十二章 作用于呼吸系统的药物	82
第一节 平喘药	82
一、肾上腺素受体激动药	82
二、茶碱类	83
三、抗胆碱药	84
四、肾上腺皮质激素	84
五、抗过敏药	85
第二节 镇咳药	86
一、中枢性镇咳药	86
二、外周性镇咳药	86
第三节 祛痰药	87
一、痰液稀释药（恶心性祛痰药）	87
二、黏痰溶解药	87
三、黏液调节药	88
第四节 作用于呼吸系统的药的用药监护	88
第十三章 作用于子宫平滑肌的药物	90
第一节 子宫平滑肌兴奋药	90
第二节 子宫平滑肌抑制药	92
第三节 作用于子宫平滑肌的药的用药监护	92
第十四章 利尿药和脱水药	94
第一节 利尿药	94
一、利尿药的作用部位与分类	94
二、常用利尿药	95
三、用药监护	97
第二节 脱水药	98

第十五章 作用于心血管系统药物	100
第一节 抗心律失常药	100
一、抗心律失常药物的电生理作用及分类	100
二、常用抗心律失常药	101
三、用药监护	104
第二节 抗心绞痛药	106
一、硝酸酯类及亚硝酸酯类	106
二、 β 受体阻断药	107
三、钙拮抗药	108
四、用药监护	109
第三节 抗慢性心功能不全药	110
一、概述	110
二、强心苷	110
三、肾素-血管紧张素-醛固酮系统抑制药	113
四、 β 受体阻断药	114
五、利尿剂	114
六、其他抗 CHF 药物	114
七、用药监护	115
第四节 抗高血压药	117
一、抗高血压药物的分类	117
二、常用抗高血压药	117
三、抗高血压药物的合理应用	124
四、用药监护	124
第十六章 血液及造血系统疾病用药	127
第一节 抗贫血药	127
一、铁制剂	127
二、叶酸 (folic acid)	128
三、维生素 B ₁₂ (vitamin B ₁₂)	129
四、用药监护	129
第二节 影响血凝过程的药物	130
一、抗凝血药	130
二、止血药	132
三、抗血小板药	133
四、溶栓药	134
五、用药监护	135
第三节 促白细胞增生药	136
一、基因重组类	136
二、维生素类	137

三、用药监护	137
第十七章 肾上腺皮质激素类药物	139
第一节 糖皮质激素	139
第二节 皮质激素抑制药	142
第三节 肾上腺皮质激素类药的用药监护	142
第十八章 甲状腺激素及抗甲状腺药	144
第一节 甲状腺激素	144
第二节 抗甲状腺药	145
一、硫脲类	145
二、碘和碘化物	146
三、放射性碘	146
四、用药监护	146
第十九章 胰岛素及口服降血糖药	149
第一节 胰岛素	149
第二节 口服降血糖药	150
一、促胰岛素释放的药物	150
二、促糖利用的药物	151
三、 α -葡萄糖苷酶抑制药	151
四、胰岛素增敏药	152
第三节 胰岛素及口服降血糖药的用药监护	152
第二十章 避孕药	155
一、女性避孕药	155
二、男性避孕药	156
三、外用避孕药	156
第二十一章 抗微生物药	158
第一节 抗菌药物概述	158
一、抗菌药物的基本概念	158
二、宿主、抗菌药物和病原体的相互关系	159
三、抗菌药物应用的基本原则	159
四、用药监护	160
五、抗生素的分类	160
六、抗生素的计量单位	161
第二节 β -内酰胺类抗生素	161
一、青霉素类	162
二、头孢菌素类	163
三、非典型 β -内酰胺类	164
四、用药监护	165
第三节 大环内酯类抗生素	166

一、概述·····	166
二、常用药物·····	167
三、其他大环内酯类·····	167
四、用药监护·····	167
第四节 氨基苷类抗生素·····	168
一、氨基苷类抗生素的共同特点·····	168
二、常用药物·····	168
三、用药监护·····	169
第五节 四环素类与氯霉素抗生素·····	170
一、四环素类·····	170
二、氯霉素·····	171
三、用药监护·····	172
第六节 其他抗生素·····	172
一、常用药物·····	172
二、用药监护·····	173
第七节 人工合成抗菌药·····	174
一、喹诺酮类·····	174
二、碘胺类药与甲氧苄啶·····	175
三、硝基咪唑类·····	176
四、硝基呋喃类·····	176
五、用药监护·····	177
第八节 抗结核病药·····	178
一、第一线抗结核病药·····	178
二、第二线抗结核病药·····	180
三、新型抗结核病药·····	180
四、抗结核病药临床应用的基本原则·····	180
五、用药监护·····	181
第九节 抗病毒药与抗真菌药·····	182
一、抗病毒药·····	182
二、抗真菌药·····	183
三、用药监护·····	185
第十节 消毒防腐药·····	186
一、概述·····	186
二、常用消毒防腐药·····	186
第二十二章 抗寄生虫病药·····	192
第一节 抗疟药·····	192
一、概述·····	192
二、常用抗疟药·····	192

三、常用抗疟药的联合应用·····	194
四、用药监护·····	194
第二节 抗阿米巴病药和抗滴虫药·····	195
一、抗阿米巴病药·····	195
二、抗滴虫病药·····	196
第三节 抗血吸虫病药·····	196
第四节 驱肠虫药·····	196
一、驱肠线虫药·····	197
二、驱绦虫药·····	197
三、用药监护·····	197
第二十三章 抗恶性肿瘤药 ·····	199
第一节 概述·····	199
一、细胞增殖周期与药物作用环节·····	199
二、抗恶性肿瘤药的分类·····	200
三、抗恶性肿瘤药的常见不良反应·····	200
第二节 常用的抗恶性肿瘤药·····	201
一、烷化剂·····	201
二、抗代谢药·····	201
三、抗肿瘤抗生素·····	202
四、抗肿瘤植物药·····	203
五、抗肿瘤激素类·····	203
六、其他抗肿瘤药·····	204
第三节 抗恶性肿瘤药的用药监护·····	204
第二十四章 解毒药 ·····	206
第一节 金属与类金属中毒的解毒药·····	206
一、含巯基解毒药·····	206
二、金属络合物·····	207
第二节 氰化物中毒解救药·····	207
一、中毒及解毒机制·····	207
二、氰化物中毒解毒药·····	208
第三节 有机氟中毒解救药·····	209
附录 1 药物学实验 ·····	211
附录 2 处方的一般知识 ·····	225
中文索引 ·····	230
英文索引 ·····	235

第一章 总 论

第一节 绪 言

一、药物和药物学的概念

药物 (drug) 是指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态, 可用以预防、诊断和治疗疾病的化学物质。药物可随剂量的增大产生毒性反应, 而毒物是指在较小剂量即对机体产生毒害作用, 损害人体健康的化学物质, 所以, 药物和毒物之间没有严格界限。一个比较理想的药物应该具有效力强, 安全性高, 选择性高, 性质稳定, 易于给药和价格低廉等特征。

药理学是运用基础医学中的生理学、病理生理学、微生物学、免疫学等的知识, 研究解释药物与机体 (含病原体) 间的相互作用的学科。其中研究药物对机体的作用部分称为药物效应动力学 (pharmacodynamics), 又称药效学; 研究药物在机体的影响下所发生的变化称为药物代谢动力学 (pharmacokinetics), 又称药动学。

药理学是药理学 (pharmacology) 发展的基础学科, 是以人为对象, 研究护理人员在临床用药中的地位和任务。它不仅介绍药物的作用、临床应用等, 还着重阐述药物不良反应及防治措施、禁忌证和用药监护等相关内容, 为防治疾病, 合理用药, 发挥药物最佳疗效, 防治不良反应以及提高执行医嘱质量提供基本理论、基本知识和科学的思维方法。

二、药理学学习目的和方法

护理人员处于临床工作的第一线, 既是药物治疗的执行者, 又是用药前后的监护者。因此, 护理人员不但要熟悉药理学的基础知识, 还应掌握如何在合理用药的同时防止并及时发现药物的不良反应, 减少药源性疾病 (drug-induced disease) 和事故的发生, 确保临床用药安全有效。当今护理工作是“以人的健康为中心”的护理模式, 应突出护理专业对药理学知识技能的特殊要求, 注重实践, 紧密结合工作实际, 提高服务于人的本领, 培养成为高素质劳动者及中等卫生职业技能型人才。通过本课程学习要求达到: ①能理解常用药物的主要作用、用途和用法; ②掌握各类药物的主要不良反应和用药注意事项; ③具有观察药物疗效和不良反应的能力和用药监测、用药护理能力; ④具有对非处方药的用药指导能力和药物咨询能力; ⑤对常用药品进行外观检查、查阅药物相互作用、检索配伍禁忌与准确换算药物剂量的能力; ⑥通过与相关学科共同努力, 具有执行处方、医嘱的能力。

药理学既是理论科学, 又是实践科学。在学习过程中, 应以理论与实践相结合的学习

方法掌握药物学的学习内容。药理学实验法是药物学的常用学习方法之一：通过以健康动物（包括清醒动物和麻醉动物）和正常器官、组织等为实验对象进行药物效应动力学和药物代谢动力学的研究；在实验过程中，通过观察实验现象分析药物的作用、药物的体内过程以及药物的不良反应，并对药物的疗效和安全性进行评价，提高药物治疗和用药监护的质量。

药理学与护理工作的关系非常密切，要成为一名称职的护理人员，必须具有丰富的药理学知识，不断提高医疗和护理水平，才能更好地为病人服务。

第二节 药物对机体的作用——药效学

一、药物作用与药物效应

（一）药物作用

药物作用（drug action）是指药物对机体的初始作用，是通过分子对机体组织的相互作用。药物效应（drug effect）是药物作用的结果，是机体反应的表现。

药物效应是机体器官原有功能水平改变，功能提高称为兴奋（excitation）；功能降低称为抑制（inhibition）。例如，肾上腺素升高血压，硫酸镁增加排便次数均属兴奋；阿司匹林退热和吗啡镇痛均属抑制。

多数药物是通过化学反应而产生药物效应的。这种化学反应的专一性使药物的作用具有特异性（specificity）。例如，普萘洛尔特异性地阻断 β 肾上腺素受体，而对其他受体影响不大，所以普萘洛尔可对抗 β 受体兴奋时所产生的效应。

（二）药物作用方式

依据药物作用部位，在未吸收之前的用药局部，所产生的直接作用称为局部作用，如口服抗酸药物中和胃酸的作用；药物在给药部位经吸收进入血液循环后，分布到体内各组织、器官产生的作用称为吸收作用，如洋地黄吸收后可直接兴奋心肌，加强心肌收缩力，改善心力衰竭症状。由洋地黄加强心肌收缩力，改善循环而产生的利尿、消肿作用则为间接作用。药物防治疾病所需的作用，多为吸收作用，也称全身作用。

（三）药物作用的选择性

组织器官对药物敏感性的差异，称为药物作用的选择性（selectivity）。有些药物可影响机体的多种功能，选择性低；有些药物只影响机体的一种功能，选择性高。例如阿托品能影响心脏、血管、平滑肌、腺体及中枢神经等器官的功能，其产生的药物效应，有的兴奋、有的抑制，呈现药物作用的选择性低。治疗量的洋地黄只对心肌有增强心肌收缩力作用，选择性高。一般而言，选择性高的药物在治疗剂量下其副作用相应较少。

二、治疗效果与不良反应

药物效应往往具有两重性——治疗效果与不良反应。

(一) 治疗效果

治疗效果也称疗效 (therapeutic effect), 是指有利于改变病人的生理、生化功能或病理过程, 使患者的机体恢复正常的药物作用结果。根据治疗作用效果, 可将治疗作用分为: 对因治疗和对症治疗。

1. 对因治疗 用药目的在于消除致病因子, 彻底治愈疾病, 称对因治疗 (etiological treatment), 如应用抗生素杀灭体内致病菌。

2. 对症治疗 用药目的在于改善症状, 称对症治疗 (symptomatic treatment)。对症治疗不能根除病因, 但对病因未明暂时无法根治的疾病, 或对某些重危急病, 如休克、高热、惊厥、心力衰竭或呼吸暂停等, 却是必不可少的。例如, 感染高热和剧烈的疼痛, 应用对症治疗药物退热及止痛, 可以避免病情进一步恶化为惊厥和休克。在临床实践中, 对因治疗与对症治疗同样重要, “急则治其标, 缓则治其本”, “标本兼治” 这是祖国医学提倡的临床实践中应遵循的原则。

(二) 不良反应

凡与用药目的无关, 并为病人带来不适或痛苦的反应统称为不良反应 (adverse reaction)。多数不良反应是药物固有的效应, 一般情况下是可预知的, 但不一定是能够避免的。少数较严重的不良反应较难恢复, 称为药源性疾病, 如庆大霉素引起的神经性耳聋, 胼屈嗪引起的红斑狼疮等。临床不合理用药同样可以造成药源性危害, 轻则引起不适, 重则可致命。为此, 护理人员在实施药物治疗过程中, 首先应对所用药物可能产生的不良反应及其防治措施有很好了解, 尽量避免或减轻药物的不良反应; 必要时, 甚至停药并采取相应的治疗措施。

1. 副反应 由于药物的选择性低, 药物效应涉及多个器官, 当某一效应用作治疗目的时, 其他与治疗目的无关的效应为副反应 (side reaction) (又称副作用)。例如, 阿托品用于解除胃肠痉挛时, 所引起的口干、心悸、便秘等就是副反应。副反应是在治疗量下发生的, 是药物本身固有的作用, 多数较轻微并可预知。

2. 毒性反应 如果想通过加大剂量或增加疗程以达到治疗目的时, 应考虑到药物的有效性是有限度的, 因为过量用药是有危险性的。用药剂量过大或药物在体内蓄积过多时发生的危害性反应, 称为毒性反应 (toxic reaction)。毒性反应一般比较严重, 而且是可以预知的, 应避免发生。急性毒性反应多损害循环系统、呼吸系统及神经系统功能; 慢性毒性反应多损害肝、肾、骨髓、内分泌系统等功能。此外, 致癌 (carcinogenesis)、致畸胎 (teratogenesis) 和致突变 (mutagenesis) 反应也属于慢性毒性反应范畴。

3. 后遗效应 停药后机体血药浓度降低到最低有效浓度 (阈浓度) 以下时, 所残存的药物效应称为后遗效应 (residual effect)。这种效应有长有短, 短的如服用巴比妥类催眠药后, 可在次晨感到困倦、乏力等不适反应; 长的如大剂量应用一些氨基糖苷类抗生素于幼儿, 偶有引起永久性耳聋的严重后遗症。

4. 停药反应 突然停药后, 原有的疾病加剧, 称为停药反应 (withdrawal reaction), 又称回跃反应。例如, 长期服用可乐定降血压, 停药次日血压将明显回升。

5. 变态反应 非肽类药物作为半抗原与机体蛋白结合为抗原后, 引起组织损伤或功能紊乱的异常免疫反应称为变态反应 (allergic reaction), 又称过敏反应 (hypersensitive reac-

tion)。该反应常见于过敏体质病人，反应性质和严重程度与用药剂量无关，与药物原有效应无关。轻微则皮疹、发热；严重则可导致造血功能系统抑制，肝、肾功能损害，休克、致死等。护理人员在应用属半抗原的药物如：抗生素、磺胺类、碘等时，必须按规定做皮肤过敏试验，但仍有少数假阳性或假阴性反应，使用时须密切观察。

6. 特异质反应 少数特异体质病人对某些药物反应特别敏感，反应性质可能与常人不同，但是与药物固有效应基本一致的有害反应，称为特异质反应 (idiosyncrasy reaction)。反应严重程度与剂量成正比，其拮抗药物可能救治有效。这是一类先天遗传异常所致的反应，例如，血浆胆碱酯酶缺乏的患者应用琥珀胆碱，易引起长时间肌肉松弛作用等。临床应用药应注意患者病史中，是否有遗传缺陷的记录，选用药物及临床监护应加以考虑。

三、药物的作用机制

药物的作用机制 (mechanism of action) 是研究药物如何与机体细胞结合而发挥作用的。大多数药物的作用来自于药物与机体生物大分子之间的相互作用，这种相互作用引起了机体生理、生化功能的改变。药物的作用机制涉及到受体、酶、离子通道、核酸、免疫系统、基因等因素。此外，有些药物通过其理化性质 (如抗酸药) 或补充机体所缺乏的物质而发挥作用。下面重点介绍药物与受体的作用机制。

(一) 受体的概念和特征

1. 受体的概念 受体 (receptor) 是一类功能性蛋白质，它能识别周围环境中某种微量化学物质 (药物或体内生物活性物质)，首先与之结合，并发挥其介导细胞信号传导作用，触发后续的生理反应和药物效应。体内能与受体特异性结合的物质称内源性配体，如神经递质、激素、自体活性物质等。能与受体特异性结合的药物称外源性配体。

2. 受体的特征 受体有如下特征：

(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 化学结构非常相似的配体，能引起同一类型受体的兴奋反应，但不同光学异构体的反应可以完全不同。

(3) 饱和性 受体数目是一定的，因此配体与受体结合的量有饱和性，所以，作用于同一受体的配体之间存在竞争现象。

(4) 可逆性 配体与受体的结合是可逆的，他们的复合物可以离解为原来的配体而非代谢物。

(5) 多样性 同一受体可广泛分布到不同的细胞产生不同效应。

(二) 作用于受体的药物分类

根据药物与受体结合后所产生的效应不同，将药物分为激动药、部分激动药、拮抗药 (阻断药)。

1. 激动药 为与受体既有较强亲和力又有较强内在活性 (效应力) 的药物，它们能与受体结合并激动受体而产生效应。例如，吗啡可激动阿片受体产生强镇痛作用。

2. 部分激动药 指药物有较强亲和力，但内在活性不强，与激动药合用还可拮抗激动药的部分效应。例如，喷他佐辛与阿片受体结合可产生弱的镇痛效应，但与吗啡合用

时,可拮抗吗啡的部分镇痛作用。

3. 拮抗药 是能与受体结合,具有较强亲和力而无内在活性的药物。它们本身不产生作用,但因占据受体而拮抗激动药的效应。例如,普萘洛尔、纳洛酮均是拮抗药。

受体占领学说认为,药物与受体结合直接引起效应,必须具备2个条件:①药物与受体结合的能力,即亲和力;②药物与受体结合后直接激动受体产生的效应力,即内在活性。作用于受体的药物分类是以此为依据的(表1-1)。

表 1-1 作用于受体的药物分类比较表

种 类	亲和力	内在活性
激动药	较强	较强
部分激动药	较强	较弱
拮抗药	较强	无

(三) 受体的调节

受体于体内的数量、亲和力以及内在活性常常会受到各种生理和药物因素的影响。因此,受体需要调节,使其处于动态平衡状态,才能维持机体内环境的稳定。受体调节的方式有2种类型:

1. 受体脱敏(receptor desensitization) 长期应用激动药后,组织或细胞对激动药的敏感性下降,使药效减弱,产生耐受性。

2. 受体增敏(receptor hypersensitization) 是与受体脱敏相反的一种现象,长期应用拮抗药或受体激动药水平降低,使受体的敏感性增高,如果突然停药,可出现反跳现象(原有疾病回复或加剧)。

第三节 机体对药物的影响——药动学

药动学是研究机体对药物的影响。药物在作用部位达到一定浓度时才能产生相应的效应,其效应浓度会因为机体对药物的吸收、分布、代谢和排泄的影响而不断变化(图1-1)。药物在体内的吸收、分布、代谢和排泄称为药物的体内过程。

一、吸 收

药物自用药部位进入血液循环的过程称为吸收(absorption)。药物必须经吸收后才能发挥全身作用。但也有例外,如某些皮肤、黏膜的局部用药,只要求产生局部作用,则不必吸收;又例如,某些抗酸药和轻泻药,虽然口服给药,但只需在肠腔内发挥作用,也无需吸收。即使这样,药物仍可能被吸收而产生吸收作用。护理人员在用药过程中,除应注意药物吸收的快慢(速度)和多少(程度),以及药物效应呈现的快慢和强弱外,还应注意下列影响药物吸收的因素:

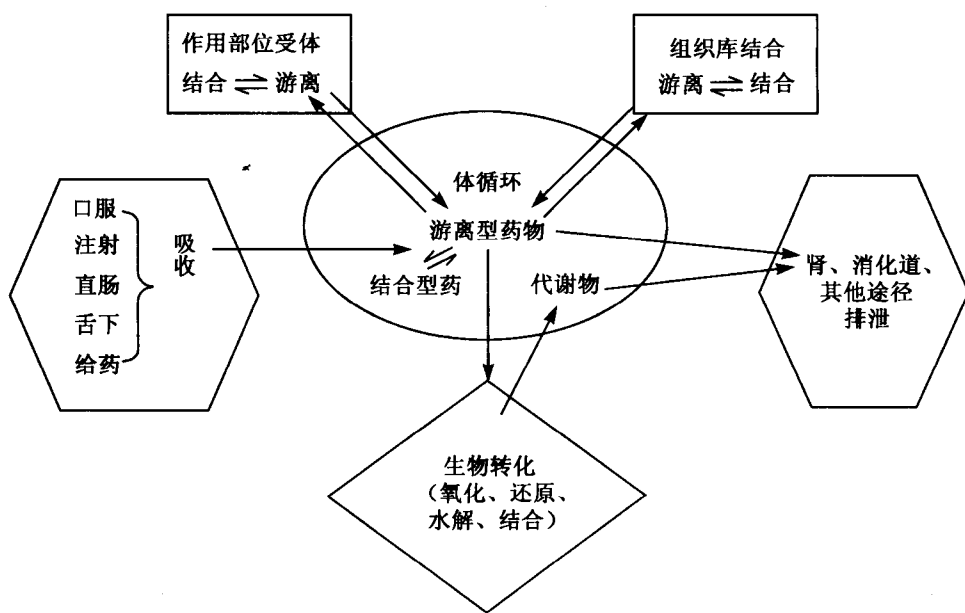


图 1-1 药物的体内过程和作用部位药物浓度变化的关系

(一) 给药途径

不同给药途径影响药物吸收的快慢顺序是：血管注射 > 吸入 > 肌肉注射 > 皮下注射 > 舌下给药 > 直肠给药 > 口服 > 皮肤给药。

1. 口服 口服是最常见的给药途径，因为方便、经济，且大多数药物在胃肠道的吸收面广泛，加上内容物的拌和作用，以及小肠适中的酸碱性（pH5 ~ 8），在对药物离解较小的因素影响下能充分吸收。但是，胃肠道分泌的酸和酶，以及肠道内菌群的生化作用均有可能在吸收前破坏药物。例如，某些青霉素类抗生素因遇胃酸灭活而口服无效；又如胰岛素因在肠内易被水解而必须注射给药。

从胃肠道吸收入门静脉系统的药物，在到达全身血液循环前必须先通过肝脏，如果肝脏对其代谢能力很强或由胆汁排泄的量大，则使进入全身血液循环内的有效药物量明显减少，这种作用称为首关消除（first pass elimination）。有的药物在被吸收进入肠壁细胞内而被代谢也属首关消除。首关消除也称首关代谢（first pass metabolism）或首关效应（first pass effect）（图 1-2）。

2. 吸入 除了气态麻醉药和其他一些治疗性气体经吸入给药外，容易气化的药物也可采用吸入途径给药，如沙丁胺醇（salbutamol）。有的药物难溶于一般溶剂，水溶液又不稳定，如色甘酸钠（disodium cromoglycate）可制成直径约 $5\mu\text{m}$ 的极微细粉末以特制的吸入剂气雾吸入。具有一定溶解度的气态药物，都能经肺通过表面积很大、血流量丰富的肺泡迅速吸收。气道本身是抗哮喘药的靶器官，临床以气雾剂解除支气管痉挛是一种局部用药。

3. 舌下给药 舌下给药可避免口服后首关消除，如硝酸甘油（nitroglycerin）口服被胃肠道吸收后通过肝脏时被代谢失活达 90%，只有少数药物能达到全身循环。若舌下给药，由血流丰富的颊黏膜吸收，直接进入全身循环，故应用比口服小得多的剂量即可有效。

4. 注射给药 静脉注射避开了吸收屏障而直接入血，故作用发挥快。但因其以很高