

湖南医学高等专科学校函授教育系列辅导资料

《药理学》自学指导书

供函授妇幼、高护专业用

主编 周 源

湖南医学高等专科学校药理学教研室

一九九六年八月

《药理学》自学指导书

(供函授妇幼、高护专业用)

周 源 主编

江苏工业学院图书馆
藏书章

湖南医学高等专科学校药理学教研室
一九九六年七月

目 录

前言

第一章~第四章 药理学总论	(2)
自测题	(4)
第五章 抗生素	(6)
第一节 β -内酰胺类	(6)
第二节 大环内酯类及其它	(7)
第三节 氨基甙类及多粘菌素类	(7)
第四节 四环素类及氯霉素	(7)
第六章 人工合成抗菌药	(9)
第一节 喹诺酮类	(9)
第二节 磺胺类和甲氧苄氨嘧啶	(9)
第三节 硝基呋喃类药	(10)
第七章 抗结核病药及抗麻风病药	(11)
第一节 抗结核病药	(11)
第八章 抗真菌药和抗病毒药	(13)
第九章 消毒防腐药	(14)
第十章 抗寄生虫药	(16)
第一节 抗疟药	(16)
第二节 抗阿米巴药及抗滴虫药	(16)
第三节 抗血吸虫药及抗丝虫药	(16)
第四节 抗肠蠕虫药	(16)
第十一章 传出神经系统药理概论	(18)
第十二章 拟胆碱药	(19)
第一节 M 胆碱受体激动药	(19)
第二节 抗胆碱酯酶药	(19)

第十三章	胆碱受体阻断药	(21)
第一节	M 受体阻断药	(21)
第二节	N 胆碱受体阻断药	(22)
第十四章	拟肾上腺素药	(23)
第一节	α 和 β 受体激动药	(23)
第二节	α 受体激动药	(23)
第三节	β 受体激动药	(24)
第四节	α 、 β 、DA 受体激动药	(24)
第十五章	肾上腺素受体阻断药	(25)
第一节	α 受体阻断药	(25)
第二节	β 受体阻断药	(25)
第十六章	中枢神经系统药理概论	(27)
第十七章	镇静催眠药	(28)
第一节	苯二氮䓬类	(28)
第二节	巴比妥类	(28)
第三节	其他类	(28)
第十八章	抗癫痫药及抗震颤麻痹药	(29)
第十九章	抗精神失常药	(31)
第一节	抗精神病药	(31)
第二节	抗躁狂药	(31)
第三节	抗抑郁药	(31)
第二十章	镇痛药	(32)
第一节	阿片生物碱类镇痛药	(32)
第二节	人工合成镇痛药	(32)
第三节	延胡索乙素及罗痛定	(32)
第二十一章	解热镇痛抗炎药	(33)
第二十二章	中枢兴奋药	(35)
第二十三章	钙拮抗药	(38)
第二十四章	抗高血压药	(38)

第一节 抗高血压药分类.....	(39)
第二节 常用的抗高血压药.....	(39)
第三节 抗高血压药的合理应用.....	(40)
第二十五章 抗心绞痛药.....	(41)
第二十六章 抗心律失常药.....	(42)
第一节 抗心律失常药对心肌电生理的影响.....	(42)
第二节 常用抗心律失常药.....	(42)
第三节 抗心律失常药的主要不良反应.....	(42)
第二十七章 抗慢性心功能不全药.....	(44)
第一节 正性肌力作用药.....	(44)
一、强心甙类药.....	(44)
二、非强心甙类正性肌力作用药.....	(44)
第二节 减轻心脏负荷的药.....	(45)
一、扩血管药.....	(45)
二、利尿药.....	(45)
第二十八章 利尿药和脱水药.....	(46)
第一节 利尿药.....	(46)
一、利尿药的分类及作用部位.....	(46)
二、常用的利尿药.....	(46)
第二节 脱水药.....	(46)
第二十九章 作用于消化系统药.....	(49)
第一节 助消化药.....	(49)
第二节 抗消化性溃疡药.....	(49)
一、抗酸药.....	(49)
二、 H_2 受体阻断药.....	(49)
三、M胆碱受体阻断药.....	(49)
第三节 泻药.....	(49)
一、容积性泻药.....	(49)
二、接触性泻药和润滑性泻药.....	(49)

四、泻药的临床应用及注意事项·····	(50)
第三十章 作用于呼吸系统药物·····	(51)
第一节 抗喘药·····	(51)
一、拟肾上腺素药·····	(51)
二、茶碱类·····	(51)
三、M 胆碱受体阻断药 ·····	(51)
四、过敏介质阻释药·····	(51)
五、肾上腺皮质激素·····	(52)
第二节 镇咳药·····	(52)
一、中枢性镇咳药·····	(52)
二、末梢性镇咳药·····	(52)
第三节 祛痰药·····	(52)
第三十一章 子宫兴奋药·····	(53)
第三十二章 作用于血液及造血系统药·····	(54)
第一节 抗凝血药·····	(54)
第二节 止血药·····	(54)
第三节 抗贫血药·····	(55)
第四节 血容量扩充剂·····	(55)
第三十三章 抗组胺药·····	(58)
第三十四章 肾上腺皮质激素类药·····	(59)
第一节 糖皮质激素类药·····	(59)
第二节 盐皮质激素·····	(59)
第三十五章 甲状腺激素与抗甲状腺药·····	(60)
第一节 甲状腺激素·····	(60)
第二节 抗甲状腺药·····	(60)
第三十六章 降血糖药·····	(61)
第一节 胰岛素·····	(61)
第二节 口服降血糖药·····	(61)
第三十七章 性激素类药物·····	(62)

第三十八章 维生素及酶类药.....	(63)
第一节 维生素.....	(63)
一 水溶性维生素.....	(63)
二 脂溶性维生素.....	(63)
第二节 酶类药.....	(63)
第三十九章 抗恶性肿瘤药.....	(66)
第四十章 免疫调节药.....	(68)
一 免疫抑制药.....	(68)
二 免疫增强药.....	(69)
第四十一章 特异性解毒药.....	(69)
第一节 有机磷酸酯中毒及其解毒药.....	(69)
第二节 金属与类金属中毒解毒药.....	(69)
第三节 氰化物中毒解毒药.....	(69)
自测试题.....	(70)
附一 自学进度表.....	(71)
附二 面授内容及时间安排.....	(72)

药学总论 第四章 前言

前 言

药学总论

为适应当前医学高等专科学校成人医学教育发展的需要,为函授学生提供与其学习特点配套的学习辅导教材,特编写此自学指导书。《药理学函授自学指导书》是以全国医学专科学校《药理学》第三版(吴景时主编)为蓝本编写而成,按教材章节顺序编排共有四十一章,每章基本都有三级要求:列入

“掌握”的内容应能准确理解、记忆并熟练地联系临床实际,“熟悉”的内容应能抓住重点记忆,“了解”内容能够基本举例说明。

药理学是研究药物与机体(包括病原体)间相互作用规律及其原理,并为临床合理用药防治疾病提供基本理论的一门医学基础学科,它以生理生化为基础,并为临床实践服务,是联接基础医学和临床医学的桥梁学科。在学习中,必须运用辩证唯物主义观点认识药物与机体间的相互作用,重点掌握各类药物的代表药,运用比较、归纳等方法,以点带面,掌握防治常见病、多发病的药物。

为检查自学程度,书后附阶段性测试题,学生应按自学进度表的规定及时完成相应自学内容的测试题以巩固学习效果。为保证自学的有序进行和面授教学的顺利,书后提供了自学进度表和面授内容及时间安排。

由于一则水平有限,二则时间仓促,书中一定有不少不足之处,恳请提出宝贵意见。

第一～四章 药理学总论

学习要求：

1. 掌握药效学和药动力学的基本概念和基本规律。
2. 熟悉影响药物作用的因素及合理用药。
3. 了解药理学的发展和学习方法。

内容提要：

一、绪论：

(一) 药理学的研究对象和任务：药理学是研究药物与机体相互作用规律的科学，它主要研究药效学、药动学两个过程，从而为临床合理用药提供理论基础。

(二) 药理学的发展：我国本草学的贡献，现代药理学发展及分支学科。

(三) 学习药理学的目的和方法。为了熟练掌握药物作用的基本规律，学习中应在掌握每类药物作用的共同规律基础上采用比较和分析的方法，区分各种药物的特性，并注意针对性地复习有关的基础医学知识。

二、药效学：研究药物的作用及作用机制。

(一) 药物的作用：药物的基本作用表现为兴奋或抑制。药物作用有选择性和两重性。量效关系的应用。

1. 选择性：绝大多数药物具有各自的选择性，这是药物分类的基础，是临床选药的重要依据。

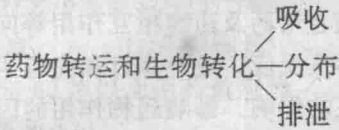
2. 两重性：防治作用和不良反应是药物作用的两个方面，后者包括副作用、毒性反应、后遗效应、继发反应、变态反应、致畸和致癌致突变等，临床用药尤其要注意克服或避免不良反应的发生，(如采取控制药物剂量和用药时间避免毒性反应)，保证用药的安全性。

3. 药物量效关系：极量指能引起最大效应而不发生中毒的剂量，也称最大治疗量；常用量即指临床应用的剂量，它介于最小有效量(阈剂量)和极量之间，一般临床用药剂量不能超过极量。药物量效曲线的理论和实际意义主要是用于药物特别是同类药物间的比较，即：①比较效价强度和效能。②比较安全性：包括治疗指数(LD_{50}/ED_{50})、可靠安全系数(LD_1/ED_{99})。

(2) 药物作用机制：大多数药物通过与受体结合而呈现作用，少数药物通过影响机体理化条件产生作用。药物与受体结合形成复合物后根据其有无内在活性，可将药物分为受体激动剂、阻断剂和部分激动剂三类。

特 点 药 物 分 类	亲和力 (与受体结合的能力)	内在活性 (效应力)	举例
受体激动剂	较强	较强	乙酰胆碱——胆碱受体激动剂
受体阻断剂	较强	无	心得安—— β 受体阻断剂
部分激动剂	较强	较弱	镇痛新——吗啡受体部分激动剂

三、药动学：研究药物体内过程的动态变化和规律。(一) 药物体内过程：包括



1. 药物转运：药物在体内的转运有被动转运和主动转运二种，被动转运（特别是脂溶扩散）是主要的转运方式。影响被动转运的因素主要有药物的理化性质（脂溶性、极性）和体液的 pH。

(1) 吸收速度与程度主要取决于药物理化性质（脂溶性、酸碱性、解离度）、环境 pH 值、剂型和给药途径。脂溶性高的药物易吸收。有机弱酸或弱碱药在不同 pH 环境中的解离和吸收情况可列表比较如下：

	酸性环境（如胃液 pH1.4）			碱性环境（如肠液 pH8.2）		
	解离	脂溶性	吸收	解离	脂溶性	吸收
弱酸药（阿司匹林）	少	大	（多）易	多	小	难
弱碱药（阿托品）	多	小	（少）难	少	大	易

临床常利用以上规律通过调节体液 pH 影响药物吸收（包括肾小管重吸收），比如阿司匹林急性中毒产生水杨酸反应时，可同服碳酸氢钠一则减少胃肠吸收，二则减少肾小管重吸收可增加肾脏排泄，降低血药浓度。片剂口服后须先崩解。溶解后才能吸收，故吸收较溶液剂慢，生物利用度可衡量药物制剂被机体吸收利用的程度。不同给药途径药物吸收快慢依次为：吸入>肌内注射>皮下注射>直肠或舌下给药>口服>皮肤给药。口服药物因有第一关卡效应（经门静脉进入肝脏被部分破坏），故显效较直肠或舌下给药慢。

(2) 影响药物分布的因素有：药物与血浆蛋白结合率、药物与组织特殊结合力，体内血脑屏障和胎盘屏障、体液 pH。

药物的吸收和分布直接关系到药物作用的快慢和强弱。

(3) 药物排泄的重要途径是肾（尿）排泄，胆汁排泄也较重要。药物在肾小管有的可

被重吸收，凡重吸收多或二个药物竞争肾小管分泌系统（如青霉素和丙磺舒）或胆汁排泄时形成肝肠循环（洋地黄毒甙）均可使药物排泄减慢，作用时间延长。

2. 生物转化：药物在体内生物转化的主要器官是肝脏，并要在药酶的催化下才能进行，如果使用药酶诱导剂，则可加速自身和另一些合用药物的转化，使药效降低。合用药酶抑制剂则相反。

排泄和生物转化构成药物的消除。药物的消除规律有恒比消除和恒量消除，前者是主要的，消除快慢用半衰期表示。半衰期（ $t_{1/2}$ ）是决定给药时间间隔的重要依据之一，也是等量多次给药时估计血药浓度达坪值的参考。一般每隔一个半衰期恒量地给药一次，给4~5个半衰期后，血药浓度达坪值。

四、合理用药及药物相互作用

（一）合理用药：应遵循的原则是：确定诊断、明确用药目的、初步选定拟用药物之后，尽可能全面地考虑影响该药作用的一切因素，仔细制订包括药物剂型、用药剂量、给药途径、给药间隔时间及用药时间、疗程、是否联合用药及药物相互作用等问题的用药方案并认真执行，用药过程中仔细观察药物疗效和不良反应，随时修订和完善用药方案，特别注意选药时排除禁忌症和考虑不良反应对合并症的影响。影响药物作用的因素主要表现在药物、机体及给药方法三个方面。药物的化学结构等是决定其作用的根本依据。在一定范围内药物剂量与作用强度成正比，但超过一定范围可发生中毒，在药典上对毒药和剧药均有极量规定，此量一般不予采用。儿童和老年人对药物的反应与成人有量或质的差异，即使相似条件的机体对有些药物也存在着个体差异（遗传因素），用药时均应加以注意。

（二）药物相互作用：临床上为增强疗效或降低不良反应，可采用联合用药的方法。但药物之间由于药动学和药效学的相互影响，可能导致疗效降低或毒副作用加重等结果，应尽量避免。

自测题

一、名词解释：

1. 药物
2. 药理学
3. 副作用
4. 效价强度
5. 效能
6. 常用量
7. 极量
8. 治疗指数
9. 受体激动剂
10. 受体阻断剂
11. 部分激动剂
12. 药酶诱导剂
13. 药酶抑制剂
14. 药物消除
15. 半衰期
16. 坪值
17. 个体差异
18. 习惯性
19. 成瘾性
20. 耐受性
21. 抗药性
22. 肝肠循环
23. 药物相互作用
24. 配伍禁忌

二、选择题：

（一）单项（最佳）选择题：

1. 下列哪项不属于药理学研究的范畴：

- | | |
|------------------|------------------|
| A. 药物对机体的作用和作用机理 | B. 药物体内过程的动态变化规律 |
| C. 制剂的制备 | D. 制剂的使用 |

2. 对极量的描述错误的是

- | | |
|--------------|----------------|
| A. 是最大治疗量 | B. 超过此量可能会引起中毒 |
| C. 在药物的安全范围内 | D. 严禁采用 |

3. 药物的基本作用表现为:

- A. 防治作用与不良反应
- B. 选择作用与普遍细胞作用
- C. 局部作用与全身作用
- D. 兴奋和抑制作用

4. 体液 pH 影响药物的转运是由于其影响了药物的

- A. 解离度
- B. 脂溶性
- C. 极性
- D. 分子大小

5. 弱酸性药物在碱性体液中

- A. 吸收快, 排泄快
- B. 吸收慢, 排泄慢
- C. 吸收慢, 排泄快
- D. 吸收快, 排泄慢

6. 下列给药途径中, 吸收速度最快的是

- A. 口服
- B. 肌内注射
- C. 舌下给药
- D. 吸入给药

7. 药物的消除是指

- A. 分布
- B. 生物转化
- C. 排泄
- D. 生物转化和排泄

8. 半衰期的大小主要取决于

- A. 吸收速度
- B. 药物剂量
- C. 原血浆浓度
- D. 消除速度

9. 药典规定 60 岁以上用药量应为

- A. 成人剂量的 1/2
- B. 成人剂量 3/4
- C. 与成人剂量相同
- D. 稍大于成人剂量

10. 某药半衰期为 12 小时, 一天两次给药, 达到坪值的时间是

- A. 半天~一天
- B. 一天~二天
- C. 二天~三天
- D. 三天~四天

第五章 抗生素

学习要求:

1. 掌握青霉素类的抗菌谱、适应症,青霉素的抗菌原理、主要不良反应及防治;掌握庆大霉素、链霉素、卡那霉素等氨基甙类药的抗菌谱、适应症及严重不良反应及防治;掌握四环素、氯霉素的抗菌谱、适应症、不良反应。

2. 熟悉大环内酯类(红霉素)及多粘菌素类的作用原理、适应症及不良反应。

3. 了解其他抗生素的作用特点与应用。

内容提要:

第一节 β —内酰胺类

一、青霉素类:包括苄青霉素和半合成青霉素。

(一) 苄青霉素即青霉素 G (penicillin G), 是 β —内酰胺类抗生素中最具代表性药物, 优点是抗菌作用快而强, 毒性低, 多数细菌不易产生抗药性。这三大优点与其抗菌作用原理密切相关。

1. 抗菌原理: 青霉素的 β —内酰胺环与粘肽合成所需转肽酶结合, 使酶失活, 粘肽合成障碍, 导致细胞壁缺损, 细菌胞外水分内渗引起菌体膨胀、裂解、死亡。青霉素为繁殖期杀菌剂。

2. 抗菌谱(抗菌范围): 胞壁粘肽含量和胞浆内外渗透压差是细菌对青霉素敏感与否的重要原因; G^+ 菌胞壁粘肽含量多且胞浆渗透压高故敏感, 而 G^- 菌胞壁粘肽含量少且胞浆渗透压低故不敏感。另外螺旋体胞壁也有一定量的粘肽。

3. 适应症: 青霉素目前是治疗敏感菌感染的首选药。

4. 不良反应: 主要为过敏反应, 严重者出现过敏性休克, 应预防为主, 措施有: ①掌握适应症, 避免局部用药。②详问过敏史。③用药前先皮试。④现配现用。⑤避免饥饿时给药。⑥备好急救药品(肾上腺素等)和器材(氧气)。一旦发生立即抢救。

(二) 半合成青霉素: 抗菌原理不良反应及防治同苄青霉素, 并存在交叉过敏反应。因为用半合成法接上不同的侧链, 获得一些耐酸、耐酶(β —内酰胺酶)、广谱的特点, 其中苯唑青霉素等耐酶青霉素具耐酸、耐酶优点, 口服有效, 主要用于抗药金葡菌感染。广谱青霉素对 G^+ 菌作用远不如青霉素 G, 但对 G^- 杆菌有效: 氨苄青霉素主要用于伤寒、副伤寒和其他抗生素无效的严重的 G^- 杆菌感染; 羧苄青霉素主要用于绿脓杆菌和变形杆菌感染。

二、头孢菌素类(先锋霉素类)与青霉素比较

(一) 相似点:

1. 化构有 β —内酰胺环

2. 抗菌原理为抑制胞壁粘肽合成而杀菌

3. 不良反应主要是过敏反应。

(二) 不同点:

1. 对 G^+ 菌作用 < 青霉素

2. 抗菌谱 > 青霉素, 对 G^- 杆菌有效。

3. 耐酶, 适用于抗药金葡感染。

4. 过敏反应发生率低。

5. 价格昂贵 (均为半合成)。

第二节 大环内酯类及其他

一、大环内酯类: 常用药物有红霉素、麦迪霉素、乙酰螺旋霉素、白霉素等, 抗菌谱与青霉素相似并略广, 对支原体有效, 但抗菌效力不如青霉素, 为抑菌剂, 临床主要用于抗药金葡菌感染及青霉素适应症的过敏者, 也用于其他敏感菌感染。抗菌原理为抑制蛋白质合成, 主要不良反应为胃肠反应和肝损害。

二、其他主要抗 G^+ 菌抗生素:

1. 林可霉素和氯林可霉素: 口服吸收后分布浓集于骨和体液, 对多数 G^+ 菌及厌氧菌有强效, 用于敏感菌所致骨髓炎效果好, 可发生严重胃肠反应。

2. 万古霉素对 G^+ 菌作用强但毒性也大 (耳毒性和肾毒性), 主要用于对其他抗生素耐药的 G^+ 菌感染。

第三节 氨基甙类及多粘菌素类

一、氨基甙类: 常用的药物有链霉素、庆大霉素、卡那霉素和丁胺卡那霉素、新霉素等。它们都有下列共同特点:

(一) 抗菌原理都是抑制蛋白合成的全过程而产生杀菌作用。

(二) 体内过程相似: 口服难吸收, 不易透过血脑屏障, 不易进入细胞内, 可透过胎盘屏障, 90% 原形经肾排泄。

(三) 抗菌谱相似: 较广, 对 G^- 菌作用强于 G^+ 菌, 链霉素和卡那霉素对结核杆菌有效。

(四) 主要毒性反应相似: 肾毒性、耳毒性、阻断神经肌肉接头和过敏反应, 应采取相应的防治措施。

(五) 各药之间有部分或完全交叉抗药性。

二、多粘菌素类: 主要通过影响细胞膜通透性而杀菌, 只对 G^- 杆菌有效, 尤其对绿脓杆菌作用强, 为绿脓杆菌感染首选药, 毒性大, 主要是肾及神经系统损害。

第四节 四环素类及氯霉素

同属广谱抗生素, 对 G^+ 菌、 G^- 菌、立克次体、衣原体等有效, 通过抑制蛋白质合成产生速效抑菌作用, 不良反应较多, 口服有效。

1. 抗菌谱广：对 G^+ 菌作用 $<$ 青霉素，对 G^- 菌作用 $<$ 氨基甙类。

3. 不良反应多：局部刺激症状、二重感染、影响骨牙生长、肝损害等。

3. 不良反应多：局部刺激症状、二重感染、影响骨牙生长、肝损害等。

对 G⁺ 菌作用 < 四环素。氯霉素可引起骨髓抑制、灰婴综合症等严重毒性反应，使其临床应用受到限制。

最佳选择题: 选项 A、B、C、D、E 中，最符合题意的一个选项是：A

1. 青霉素的抗菌原理是

- A. 抑制胞壁合成 B. 影响胞膜通透性
C. 抑制蛋白合成 D. 抑制核酸代谢

2. 对青霉素易产生抗药性的是

- A. 链球菌 B. 肺炎球菌 C. 金葡菌 D. 脑膜炎双球菌

3. 对青霉素皮试的描述哪项是错误的

- A. 皮试前应询问过敏史 B. 停用三天须重新皮试
C. 皮试阴性则完全可放心使用青霉素 D. 更换批号应重做皮试

4. 下列哪项不是青霉素的适应症:

- A. 流脑 B. 梅毒 C. 大叶性肺炎 D. 肺炎

5. 金葡菌引起的急慢性骨髓炎应首选

- A. 四环素 B. 红霉素 C. 氯林可霉素 D. 青霉素

6. 通过抑制蛋白质合成而产生杀菌作用的抗生素是

- A. 青霉素 B. 头孢菌素 C. 庆大霉素 D. 多粘菌素

7. 链霉素过量致呼吸衰竭时应立即静滴

- A. 肾上腺素 B. 地塞米松 C. 尼可刹米 D. 10%葡萄糖酸钙

8. 以下何种细菌感染首选四环素:

- A. 金葡菌 B. 大肠杆菌 C. 抗药金葡菌 D. 立克次体

9. 灰婴综合症是下面哪一药物特有的不良反应

- A. 链霉素 B. 四环素 C. 氯霉素 D. 氯林可霉素

10. 下列哪个药物不属广谱青霉素:

- A. 氨苄青霉素 B. 苯唑青霉素 C. 羧苄青霉素 D. 羟氨苄青霉素

第六章 人工合成抗菌药

磺胺类和喹诺酮类

学习要求：掌握磺胺类药物的作用原理、抗菌谱、体内过程、用途、不良反应及防治；掌握甲氧苄氨嘧啶的作用、应用。了解硝基咪唑类和喹诺酮类的特点。

1. 掌握磺胺类药物的作用原理、抗菌谱、体内过程、用途、不良反应及防治；掌握甲氧苄氨嘧啶的作用、应用。

2. 了解硝基咪唑类和喹诺酮类的特点。

内容提要：

第一节 喹诺酮类

本类具有口服易吸收、高效、广谱、不良反应少等优点，并且抗菌机理为阻止 DNA 复制，故与 β -内酰胺类和氨基甙类抗生素无交叉抗药性。第一代萘啶酸口服吸收后以原形从肾排出，用于 G^- 杆菌所致尿路感染；第二代吡哌酸抗菌作用增强，对 G^- 杆菌作用 $>$ 氨苄青霉素，主要用于尿路感染、肠道及呼吸道感染；第三代氟喹诺酮类，抗菌谱更广，抗菌作用更强，广泛用于各种全身性感染。

第二节 磺胺类和甲氧苄氨嘧啶

一、磺胺类：

1. 作用和作用原理：磺胺化学结构和 PABA（对氨基苯甲酸）相似，竞争抑制二氢叶酸合成酶，抑制细菌核酸代谢而产生抑菌作用。

2. 抗菌谱：较广，包括 G^+ 菌、 G^- 菌、沙眼衣原体、疟原虫等。

3. 体内过程：

(1) 肠道易吸收类磺胺口服吸收好，在血中与血浆蛋白结合（其中 SD 结合率最低，易通过血脑屏障），影响药物分布和排泄。经肝乙酰化后代谢产物及磺胺原形经肾排泄时易在酸性尿中饱和析出结晶损害肾。

(2) 肠道难吸收类在肠腔浓度高，在肠内产生抑菌作用后由肠道排出。

4. 用途：根据感染部位选择肠道易吸收类、肠道难吸收类或外用磺胺。

(1) 全身性感染：选肠道易吸收类，流脑首选 SD。

(2) 肠道感染选肠道难吸收类如 SG、PST、SAPA 等。

(3) 皮肤、粘膜（眼）感染选外用类磺胺如 SML、SD-Ag、SA-Na 等。

5. 不良反应及防治：主要为肾损害，尤以 SD、SMZ 易发生，可采用多饮水、同服等量碳酸氢钠（碱化尿液）；定期检查尿液等预防措施，老年人、尿少、肾功能不良者慎用。

二、甲氧苄氨嘧啶（TMP）：抗菌谱与磺胺相似，为广谱抑菌剂。抗菌原理系抑制二氢叶酸还原酶，与磺胺药合用对同一叶酸代谢呈双重阻断作用，可产生杀菌作用，因 TMP 能

增强磺胺药及多种抗生素的作用，又称抗菌增效剂，故常与磺胺药组成复方制剂（复方新诺明、双嘧啶片），用于敏感菌引起的多种感染。

第三节 硝基呋喃类药

呋喃类药抗菌谱广、不易产生抗药性、与其他抗菌药无交叉抗药性，但毒性大限制其应用。

1. 呋喃妥因（呋喃咀啉）：口服吸收好，尿中药浓达有效水平，主要用于治疗泌尿道感染。
2. 呋喃唑酮（痢特灵）：口服吸收差，主要用于肠道感染。
3. 呋喃西林：毒性大，仅用作表面消毒剂，治疗化脓性中耳炎、伤口感染等。

自测题

最佳选择题：

1. 磺胺类药抗菌原理是：

- A. 抑制细胞壁合成 B. 抑制蛋白质合成
C. 抑制二氢叶酸还原酶 D. 抑制二氢叶酸合成酶

2. 治疗流脑应首选

- A. 磺胺嘧啶（SD） B. 磺胺甲基异噁唑 C. 磺胺异噁唑 D. 磺胺醋酰

3. 关于磺胺药的用药注意事项错误的是

- A. 询问过敏史 B. 定期检查尿 C. 定期检查血 D. 合用维生素C以增强药效

4. TMP与磺胺药合用的目的不包括

- A. 增强抗菌作用 B. 延缓抗药性 C. 减轻肾损害 D. 扩大抗菌谱

5. 长期使用呋喃咀啉引起的不良反应是

- A. 肾损害 B. 外周神经炎 C. 过敏反应 D. 溶血反应

6. 第二代喹诺酮类代表药是

- A. 萘啶酸 B. 吡哌酸 C. 氟哌酸 D. 氟嗟酸

7. 呋喃西林限于局部外用原因

- A. 口服难吸收 B. 毒性大 C. 刺激性大 D. 胃肠反应明显