

湖南省中等卫生学校护士专业试用教材

药 理 学

湖南省卫生厅科教处

一九九〇年五月

湖南省中等卫生学校护士专业试用教材

药 理 学

主 编	曹楚兵	
编 委	阙克清	郭希夷
	胡回熊	李慧秀
	曹楚兵	

江苏工业学院图书馆
藏书章

湖南省卫生厅科教处

一九九〇年五月

湖南省护士专业试用教材说明

卫生部陈敏章部长在全国中等医学教育工作会议上指出：“中等医学教育教学改革的中心任务是：打破在教学工作中的传统模式，把中等医学教育从类同于高等教育的‘学院型’改变为‘实用型’，以适应改革后的城、乡卫生工作对中等卫生技术人才的需要”。湖南省卫生厅根据此精神，选定护士专业为中等医学教育改革的试点专业，按照培养“实用型”护理人才这一目标，修订护士专业教学计划和各学科的教学大纲，组织有关专业教师编写供全省护士专业教改试点班使用的新教材。

试用教材共有18种：包括医学伦理学、医用化学、医用遗传学、解剖学及组织胚胎学、生物化学与生理学、微生物学与寄生虫学、病理学、药理学、护理心理学、基础护理学、内科护理学、外科护理学、儿童护理学、传染病护理学、妇产科护理学、眼耳鼻咽喉及口腔护理学、卫生学、针灸与理疗等。为了使新编的教材服从于培养目标，具有较强的专业性和实用性，强调教材的编写，应根据强化培养目标，淡化学科意识，加强基本技能训练的原则，取舍教学内容，以体现护理学是一门综合应用型学科，有利于提高护士素质。在编写程序上分两阶段进行，第一阶段：由担负护士专业教学改革试点学校，按学科分工，选定具有讲师以上职务的任课教师为主编，邀请省内其他卫校富有教学和临床经验的讲师，高级讲师参加编写，先根据修订的教学计划与教学大纲，编写试用教材，在护士专业教改试点教学班使用，以便在教学实践过程中发现问题予以修改；第二阶段：试用教材经修改后，确认该教材符合教学改革的要求，质量较好，再邀请省内高等医学院校有关专家、教授主审定稿，然后组织出版发行。其目的在于保证书稿内容的科学、新颖和实用。

为了便于任课教师安排教学进程和指导学生学习，本教材后附有教学大纲和实习、实验指导。教材建设是一项长期而艰巨的任务，编写适合护士专业教学改革的系列教材亦属初次尝试，因此，书中不足之处，难以避免，有待于广大师生与读者的批评指正，以便不断修改完善。

科 教 处

一九九〇年五月

目 录

第一章 绪论.....	(1)
第二章 药物的体内过程——药动学.....	(2)
第三章 药物对机体的作用——药效学.....	(8)
第四章 护士用药应注意的基本问题.....	(12)
第五章 药物的一般知识.....	(18)
第六章 传出神经系统药理概述.....	(23)
第七章 拟胆碱药和有机磷酸酯类的毒理及其解救药.....	(28)
第一节 拟胆碱药.....	(28)
第二节 有机磷酸酯类的毒理及其解救药.....	(30)
第八章 抗胆碱药.....	(34)
第九章 拟肾上腺素药.....	(39)
第十章 抗肾上腺素药.....	(46)
第十一章 局部麻醉药.....	(49)
第十二章 全身麻醉药.....	(52)
第十三章 镇静催眠药和抗焦虑药.....	(57)
第十四章 抗癫痫药.....	(63)
第十五章 抗精神失常药.....	(66)
第十六章 镇痛药.....	(72)
第十七章 解热镇痛药.....	(77)
第十八章 中枢兴奋药.....	(83)
第十九章 治疗心功能不全药.....	(86)
第二十章 抗心律失常药.....	(93)
第一节 常用抗心律失常药.....	(93)
第二节 抗心律失常药用药护理.....	(97)
第二十一章 抗心绞痛药.....	(99)
第二十二章 抗高血压药.....	(103)
第一节 中枢性交感神经抑制药.....	(103)
第二节 抗肾上腺素能神经药.....	(104)
第三节 肾上腺素受体阻滞药.....	(105)
第四节 血管平滑肌松弛药.....	(106)
第五节 利尿药.....	(107)
第六节 影响血管紧张素Ⅱ形成药.....	(107)
第七节 慢通道阻滞药.....	(107)

第八节	抗高血压药用药护理	(108)
第二十三章	利尿药和脱水药	(109)
第一节	利尿药	(109)
第二节	脱水药	(113)
第二十四章	组胺及抗组胺药	(115)
第一节	组胺	(115)
第二节	抗组胺药	(115)
第二十五章	镇咳、平喘、祛痰药	(118)
第一节	镇咳药	(118)
第二节	平喘药	(119)
第三节	祛痰药	(123)
第二十六章	消化系统药	(125)
第一节	助消化药	(125)
第二节	治疗溃疡病药	(126)
第三节	止吐药	(128)
第四节	泻药与止泻药	(129)
第五节	治疗肝昏迷药	(132)
第二十七章	作用于血液和造血系统药	(134)
第一节	抗贫血药	(134)
第二节	止血药及抗凝血药	(136)
第三节	血容量扩充药	(141)
第二十八章	调节水、电解质及酸碱平衡药	(143)
第二十九章	维生素	(147)
第三十章	子宫兴奋药	(152)
第三十一章	性激素类药	(155)
第三十二章	计划生育用药	(159)
第三十三章	甲状腺激素和抗甲状腺药	(162)
第三十四章	降血糖药	(166)
第三十五章	肾上腺皮质激素	(169)
第三十六章	抗微生物药概论	(176)
第三十七章	抗生素	(179)
第一节	β -内酰胺类抗生素	(179)
第二节	氨基甙类抗生素	(186)
第三节	四环素类和氯霉素	(189)
第四节	其它抗生素	(193)
第三十八章	磺胺类药及其它合成抗菌药	(197)
第一节	磺胺类	(197)
第二节	甲氧苄胺嘧啶	(201)

第三节	硝基呋喃类和其它合成抗菌药.....	(202)
第三十九章	抗结核病药和抗麻风病药.....	(205)
第一节	抗结核病药.....	(205)
第二节	抗麻风病药.....	(209)
第四十章	抗真菌药和抗病毒药.....	(210)
第一节	抗真菌药.....	(210)
第二节	抗病毒药.....	(213)
第四十一章	消毒防腐药和皮肤粘膜用药.....	(215)
第一节	作用机理.....	(215)
第二节	常用药物.....	(216)
第三节	消毒防腐药用药护理.....	(224)
第四十二章	抗疟药.....	(226)
第一节	主要用于控制症状的药物.....	(226)
第二节	主要用于控制复发和传播的药物.....	(227)
第三节	主要用于病因性预防的药物.....	(228)
第四十三章	抗阿米巴病药和抗阴道滴虫病药.....	(229)
第四十四章	抗血吸虫病药和抗丝虫病药.....	(231)
第一节	抗血吸虫病药.....	(231)
第二节	抗丝虫病药.....	(231)
第四十五章	驱肠虫药.....	(233)
第一节	抗肠线虫药.....	(233)
第二节	抗绦虫病药.....	(234)
第四十六章	抗恶性肿瘤药.....	(236)
第一节	概述.....	(236)
第二节	常用抗恶性肿瘤药.....	(238)
第四十七章	解毒药.....	(243)
第一节	金属和类金属中毒的解毒药.....	(243)
第二节	氰化物中毒的解毒药.....	(245)
第四十八章	诊断用药.....	(248)
第一节	X 线造影剂.....	(248)
第二节	器官功能检查用药.....	(250)
第四十九章	影响免疫功能的药物.....	(252)
第五十章	药物相互作用.....	(255)

第一章 绪 论

一、药理学研究内容和任务

药物 是指能对机体(含病原体)某种生理、生化机能发生影响,用于预防、诊断、治疗疾病或进行计划生育的化学物质。

药理学 是研究药物与机体相互作用规律的一门学科。也是为临床防治疾病、合理用药提供基本理论的医学基础课。一方面研究药物对机体的作用和作用机理,称为药物效应动力学,简称药效学;另一方面研究机体对药物的处置过程及其规律,称为药物代谢动力学,简称药动学。因而药理学主要阐明药物对机体的作用规律和作用机理,药物在体内的过程,指出药物在临床的应用,如适应症、用法、不良反应和禁忌症等。

药理学的任务主要是帮助医务工作者正确合理用药,提高药物防治疾病的效果,减少毒副反应;其次在发展新药和发掘祖国医药学宝贵遗产的工作中也起重要的作用。

二、学习药理学的目的要求

药理学是基础医学与临床医学间的一门桥梁学科,在学习过程中要联系生理学、生物化学、微生物和寄生虫学,以及病理学等知识,来理解药物的作用、适应症及不良反应。在掌握药物作用基本理论的基础上,分析每类药物的共性,对重点药物应全面掌握其作用、用途、用法、不良反应和观察,以及用药护理;再比较同类药物各自的特性。

用药护理即药物治疗的护理。护士在用药时,必须观察药物的作用和不良反应,运用药理学、护理学、心理学及其它社会科学等专业知识,参与疾病预防及药物治疗,而不是盲目地执行医嘱。护理是否恰当,将显著影响药物疗效。

复 习 思 考 题

- 1、什么是药物? 药理学研究内容和任务是什么?
- 2、护士学习药理学的重要内容是哪些?

(衡阳市卫校 阙克清)

第二章 药物的体内过程—药动学

药物的体内过程是机体对药物的处置过程，即药物在体内的转运和转化。转运是指药物分子在体内空间位置的改变，包括药物的吸收、分布和排泄，而药物的化学结构在体内发生改变则称为生物转化或药物代谢。药动学是研究药物体内过程和血药浓度随时间变化规律的科学，对于指导临床用药十分重要。

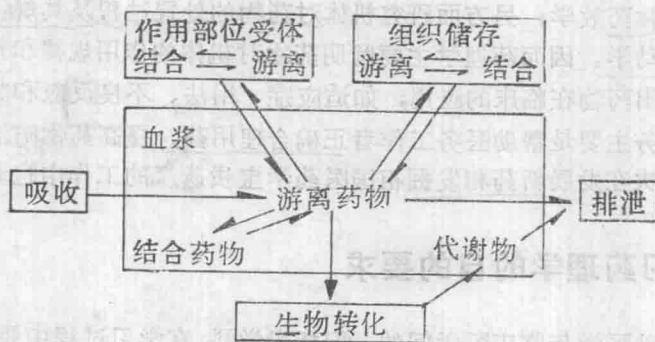


图 2—1 药物体内过程示意图

一、药物的转运

(一) 药物的跨膜转运

药物到达作用部位且能产生药理效应，首先要通过体内的细胞膜，即进行跨膜转运。细胞膜的结构是以液态的脂质双分子层为基架，其中镶嵌着具有多种功能的球状蛋白质。膜上还有贯穿膜内外充水的孔道称为膜孔。药物跨膜转运的方式有：

1、被动转运 药物顺浓度差转运，不需消耗能量。

(1) 简单扩散(脂溶扩散) 脂溶性药物可溶于细胞膜的脂质，由浓度高的一侧扩散到浓度低的一侧，大多数药物是以这种方式进行转运。脂溶性越大的药物，愈容易扩散。体液的PH值可以影响药物的解离程度，解离型药物极性高，难以通过简单扩散而转运，非解离型药物脂溶性大，易于扩散。弱酸性药在碱性体液中易于解离，弱碱

性药在酸性体液中易于解离，当膜两侧PH不同时，弱酸性药易自酸侧进入碱侧，弱碱性药易由碱侧进入酸侧。

(2) 膜孔扩散(滤过) 凡分子量小于100，直径小于膜孔的水溶性药物，经过细胞膜的膜孔扩散，如乙醇、尿素等。借助膜两侧的渗透压差、浓度差和电位差而扩散。

(3) 易化扩散 少数药物与细胞膜上的特异性载体结合后引起蛋白质构形改变，将药物转运到细胞内。这种依靠特异性载体顺浓度差扩散，不耗能又加快转运速度的过程称易化扩散。如红细胞摄取葡萄糖和氨基酸，维生素B₁₂在小肠吸收，均经易化扩散转运。

2、特殊转运

(1) 主动转运 药物依靠膜上特异性载体蛋白，由低浓度侧向高浓度侧转运过程，需要消耗能量。象水泵引水上山需要消耗能量，形象地称膜泵转运，如碘泵、胺泵分别转运碘或儿茶酚胺类药物。对药物的分布和排泄影响较大。

易化扩散和主动转运都需要载体，这类载体对被转运药物的化学结构有特异性要求。载体的数量有限，因而转运能力有限，转运过程出现饱和现象；如果两种药物为同一载体转运时，相互间就存在竞争性抑制作用。

(2) 胞饮转运 某些药物可以被细胞膜内陷形成的小泡吞噬而进入细胞内。

(二) 吸收

药物从用药部位进入血液循环的过程称吸收。吸收的程度和快慢往往影响药物作用强度和快慢。

1、吸收部位及其特点

(1) 消化道吸收 口服药物主要以被动转运方式经胃肠道粘膜吸收。弱酸性药可从胃中吸收，但胃吸收表面积较小，药物停留时间短，吸收量少。吸收的主要部位在小肠，因其表面具绒毛，吸收面积大，肠蠕动快，血流量大，肠内PH4.8~8.2，弱酸及弱碱性药均易溶解吸收。药物从胃肠道吸收以后，都经过门静脉进入肝脏，再进入体循环。

少数药物可用舌下给药或直肠给药，分别通过口腔、直肠和结肠粘膜吸收。吸收面积虽小，但血流丰富，药物迅速吸收到体循环，而不必首先通过肝脏。

(2) 首过代谢(第一关卡效应) 指口服给药的过程中，药物首先经门脉进入肝脏，有些药物在肠粘膜或进入肝后被酶代谢，以致进入体循环的药量减少，称首次通过代谢，简称首过代谢，又叫第一关卡效应。

(3) 消化道外吸收 皮下或肌肉注射的药物通过毛细血管即被吸收，毛细血管细胞间隙较大，故吸收迅速而完全。但在外周循环衰竭时宜采用静脉给药。

呼吸道给药 气体或挥发性的药物可由肺泡上皮细胞吸收，起效迅速。

皮肤给药 只有少数脂溶性强的药物，如硝酸甘油、有机磷酸酯类可通过完好的皮肤吸收。

2、生物利用度 是指药物制剂被机体吸收利用的程度。同一药物，剂量相同而剂型不同，甚至同一药厂生产的相同剂型而批号不同，口服后也有可能疗效差异很大，血

药浓度可相差数倍。因而生物利用度是衡量药物制剂在临床应用有效性的质量标准，应引起注意。

(三) 分布

药物从血液转运到各组织器官的过程称为分布。大多数药物在体内的分布是不均匀的，这主要取决于下列各因素。

1、与血浆蛋白结合

药物吸收入血后，部分药物与血浆蛋白呈疏松可逆性结合，结合的药物由于分子量增大，不能跨膜转运，暂无药理活性，不被代谢和排泄，在血液中暂时贮存。游离型药物转运到作用部位发挥药理活性，游离型药物浓度与作用强度呈正比。当游离型药物被分布代谢或排泄，血药浓度降低时，结合型药物逐渐分离，二者保持动态平衡。

与药物结合的蛋白质主要是白蛋白。治疗量药物与血浆蛋白结合的百分率称血浆蛋白结合率。由于是非特异性结合，如同时应用两种结合率高的药物，可在血浆蛋白结合部位竞争性置换出另一药物，使后者游离型药物骤增，其作用或毒性将会增强。

2、生理屏障

血脑屏障 是指脑细胞、脑脊液和血液之间存在一种脂溶性屏障而言。脂溶性高的药物以简单扩散方式通过血脑屏障，而对许多水溶性药物则不易通过，从而影响药物分布。新生儿血脑屏障发育不完全，中枢神经系统易受某些药物影响。脑膜存在炎症时，有些药物可以透过，如青霉素、链霉素在脑脊髓膜炎时，脑脊液中可达到有效抗菌浓度。

胎盘屏障 是由胎盘将母体与胎儿血液隔开的屏障，它的通透性与一般细胞膜无明显区别，故应注意某些药物能进入胎儿循环引起畸胎或对胎儿有毒性，故孕妇用药要慎重。

3、组织的亲和力

某些药物对细胞成分具有特殊亲和力。如碘主要集中在甲状腺；钙主要沉积于骨骼中。有时药物分布到的一些组织，不是发挥作用的场所，如硫贲妥钠再分布到脂肪组织，这种分布可称为储存。

4、体液的PH

在生理条件下，细胞内液PH约为7.0，细胞外液约为7.4。弱酸药在细胞外液解离多，浓度略高于细胞内液；弱碱药则相反，细胞内浓度略高于细胞外。升高血液PH，可促进弱酸药向细胞外转运。

(四) 排泄

药物及其代谢物通过不同途径排出体外的过程称排泄。肾脏是排泄药物的重要器官，胆汁、乳腺、唾液腺、汗腺、肺、肠道均可排泄药物。

1、肾脏排泄 肾小球毛细血管膜孔较大，血浆游离型药物及其代谢物均可滤过进入肾小管。有些弱酸性药（如丙磺舒、青霉素）、弱碱性药（如普鲁卡因、奎宁）分别通过主动转运过程从近曲小管分泌排出，但这种载体选择性不高，同类药物合用时可发生竞争性抑制，如丙磺舒与青霉素合用时，丙磺舒竞争载体抑制青霉素的分泌，提高青霉素的血药浓度。弱酸性药和弱碱性药在肾小管内浓度高于血浆时，可通过简单扩散而重吸收。尿液的PH能影响药物从肾脏排泄速度，弱酸性药在碱性尿液中解离型增多，

重吸收少，排泄加快。

2、胆汁排泄和肠肝循环 许多药物经肝脏排入胆汁，随胆汁排入肠腔，后经粪便排出。而某些药物在肠腔内又被重吸收形成肝肠循环。肝肠循环量多的药物，作用持续时间将会延长，如强力霉素。

3、乳腺排泄 多属被动转运。乳汁偏酸、弱碱药如阿托品、麦角碱类，吗啡等易自乳汁排出。哺乳期妇女用药应注意对乳儿产生不良反应。

二、药物转化（药物代谢）

（一）药物转化的部位和意义

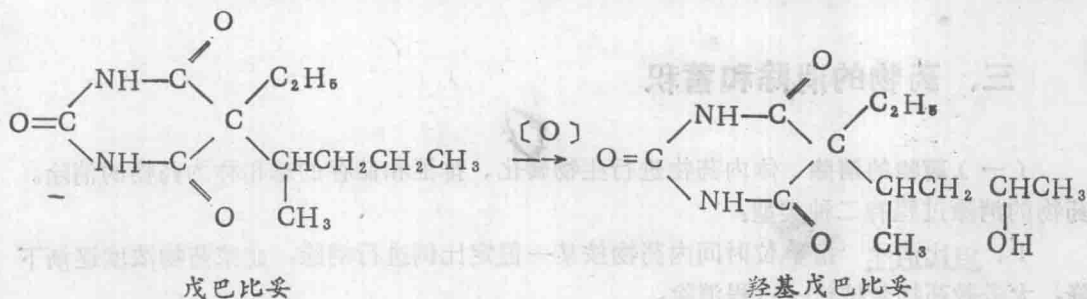
药物转化又称药物代谢，或称生物转化，是依靠酶催化的化学反应。肝脏是药物代谢的主要器官，其它如肺、肾、肠粘膜、血液、胎盘等处亦可发生。药物转化的意义有二：一是改变药理活性，使活性药物转化为无活性代谢物，称为灭活；亦可使无活性药物成为有活性药物，称为活化。二是增强脂溶性药物或其代谢物的水溶性，不易被肾小管重吸收从而加速其自肾的排泄。

（二）药物转化的步骤和方式

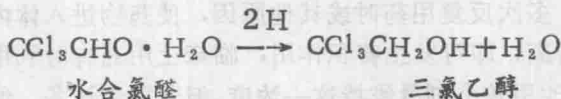
药物转化按在体内代谢的步骤可分为两步：

第一步：包括氧化、还原和水解反应，主要改变药理活性。

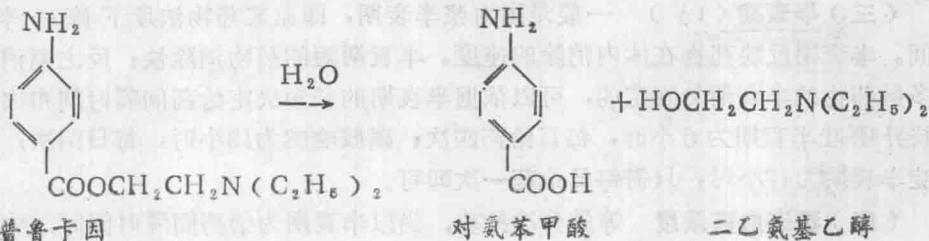
1、氧化 最为常见。如戊巴比妥、去甲肾上腺素的氧化和醇的氧化等。



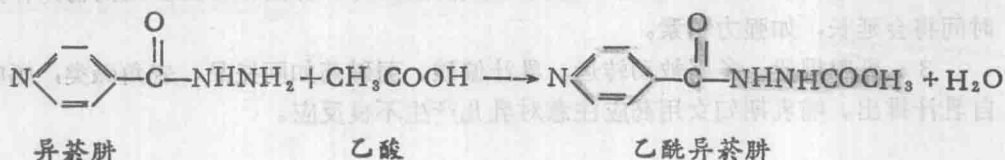
2、还原 如氯霉素的确基还原为氨基，水合氯醛还原为三氯乙醇。



3、水解 如普鲁卡因经酯酶、利多卡因由酰胺酶水解。



第二步：结合 经第一步转化的药物代谢产物或原形药物结构上的羧基、羟基或胺基，能与体内的葡萄糖醛酸、硫酸、甘氨酸或乙酸发生结合反应，使代谢物的水溶性增高，药理活性降低或消失，再经肾脏排出。



(三) 药物代谢酶系

1、肝微粒体酶系统 是肝脏代谢药物的主要酶系统，专一性低，约有 200 多种药物经它代谢，故又称药酶。是一组混合功能的酶系统，组成中细胞色素P450最为重要，它是一种多功能氧化还原酶，主要催化药物氧化反应，或使药物还原。此外还包括有酰胺水解酶，葡萄糖醛酸结合酶等。

2、非微粒体酶 少数药物可在其它组织被非微粒体酶催化代谢。如胞浆中的黄嘌呤氧化酶、线粒体中单胺氧化酶，以及血浆中的假胆碱酯酶。

(四) 药物对肝药酶的影响

1、药酶诱导 有些药物可使肝药酶活性增高或使药酶合成加速。如苯巴比妥的药酶诱导作用很强，连续用药可加速四环素、肾上腺皮质激素的破坏和加速自身的代谢。

2、药酶抑制 有些药物能抑制药酶活性，如氯霉素、异菸肼、阿斯匹林等。例如氯霉素使苯妥英钠在肝内代谢减慢，血药浓度升高，甚至引起毒性反应。

三、药物的消除和蓄积

(一) 药物的消除 体内药物进行生物转化、排泄和储存的总和称为药物的消除。药物的消除过程有二种类型：

1、恒比消除 指单位时间内药物按某一恒定比例进行消除，血浆药物浓度逐渐下降，大多数药物是按这一过程消除。

2、恒量消除 即单位时间内药物消除的量是恒定的。

(二) 药物的蓄积 多次反复用药时或其他原因，使药物进入体内的速度大于消除的速度，药物浓度逐渐升高，即可发生蓄积作用，临床上用药有时利用药物在体内的逐渐蓄积，达到治疗作用后改用较小剂量维持这一浓度。但若用量过多、给药过快或过久，使药物在体内蓄积过多，即可引起蓄积中毒。

(三) 半衰期 ($t_{1/2}$) 一般是指血浆半衰期，即血浆药物浓度下降一半所需的时间。半衰期反映药物在体内消除的速度。半衰期短的药物消除快，反之则消除慢。由于多数药物的半衰期是固定的，可以依据半衰期的长短决定给药间隔时间和次数。例如磺胺异噁唑半衰期为 6 小时，每日给药四次；磺胺嘧啶为 13 小时，每日两次；磺胺甲氧嘧啶半衰期为 47 小时，只需每日给药一次即可。

(四) 稳态血药浓度 等量分次给药，当以半衰期为给药间隔时间时，约经 5 个半

每天多次. 坪值↑

衰期血浆药物浓度可达到相对稳定水平, 此时药物吸收与消除的速度相等, 以后继续给药, 血药浓度不再发生很大改变, 这一恒定水平称“稳态血药浓度”, 又称“坪值”, 坪值高低与每日给药总量成正比, 坪值高限、低限差距则与每次用药剂量成正比。临床有时需要迅速产生效应, 开始用负荷量(即使血药浓度迅速达到坪值的量, 或维持量加倍), 后用维持量, 磺胺类药物多采用此种负荷量——维持量给药法。

复习思考题

- 1、药物以哪些方式通过细胞膜? 简单扩散为什么是药物转运的重要方式?
- 2、药物可经哪些部位吸收? 各有何特点?
- 3、影响药物分布的主要因素有哪些? 是怎样影响分布的?
- 4、肾脏、胆汁、乳汁排泄药物各有何特点?
- 5、药物代谢有哪些阶段和方式? 药酶诱导剂和抑制剂对药物作用有何影响?
- 6、体液不同PH值对药物转运有何影响?
- 7、何谓半衰期? 对临床用药有何实际意义?

(衡阳市卫校 阙克清)

第三章 药物对机体的作用—药效学

一、药物的基本作用

(一) 药物作用与药物效应 药物作用是指药物与机体组织间的始初作用,即药物最初引起的变化;药物效应是药物作用引起机体生理生化机能甚或形态的改变,即药物作用引起的继发性变化,严格地说是有区别的。例如,肾上腺素具有兴奋支气管平滑肌 β -受体的作用,最终显示出支气管平滑肌松弛的效应。但有时将二者当作同义词,互相通用。

(二) 兴奋作用和抑制作用 药物通过影响机体固有的生理功能发挥作用,可表现为机能活动的增强或减弱,例如血压的升高或降低、尿量增多或减少,呼吸加快或减慢,代谢增强或减弱。凡使机能活动增强者称为兴奋作用;凡使机能活动降低者则称为抑制作用。

(三) 局部作用和吸收作用 局部作用是指药物未被吸收前,在用药部位所出现的作用,例如碘酊用于皮肤表面的消毒作用;吸收作用是指药物吸收入血液后,随着血流分布至全身各组织、器官所出现的作用,例如阿斯匹林的解热镇痛作用。吸收作用的范围较广,可涉及全身各部位,但由于药物作用有选择性,吸收后仅对某一器官发挥明显的作用。局部作用亦可通过神经反射引起全身性反应。

(四) 药物作用的选择性 许多药物在适当剂量时对某一组织或器官作用明显,而对其它部位作用轻微或几无作用,称药物作用的选择性或选择性作用。产生选择性作用的基础可能由于某一组织细胞对药物的敏感性高,或药物与受体亲和力大有关;药物分布不均匀性也是呈现选择性作用原因之一。药物作用的选择性是相对的,小剂量时只作用于个别器官,剂量增大作用范围也扩大。但其代表了药物的主要作用,是药物分类的重要基础,也是临床选药的主要依据。

(五) 治疗作用与不良反应 用药的目的在于防治疾病。凡能达到防治效果的作用称治疗作用;但也可出现有害的不良反应。这是药物作用的二重性。临床用药应充分发挥药物的治疗作用,避免不良反应的发生。

1、治疗作用 一般分为对因治疗和对症治疗。药物作用能消除致病因素的称对因治疗,又称治本。如用抗生素杀灭体内病原菌,根治感染性疾病;能够改善疾病症状的治疗称为对症治疗,如感冒发烧用退热药,骨折剧痛用镇痛药。对症治疗不能消除病因,但能缓解症状,解除病人痛苦,防止病情恶化,又称治标。在病人处于休克、哮喘、惊厥或心力衰竭时,及时的对症治疗是不可缺少的。故对因治疗和对症治疗应根据病情灵活运用,祖国医学提出“急则治标,缓则治本,标本兼顾”确是宝贵经验。

2、不良反应

(1) 副作用: 在治疗量时出现的与治疗目的无关的作用称副作用。主要由于药物作用选择性低,作用范围广,当某一作用符合治疗目的时,其它作用可成为副作用。有些副作用可以设法纠正或消除。例如,抗酸药氢氧化铝可产生便秘,三硅酸镁可引起轻

泻，将二者组成复方，副作用则可相互抵消。

(2) 毒性反应：绝大多数药物剂量过大或用药时间过长可引起毒性反应，出现机体机能或结构的病理变化，对不同器官或系统造成损害。立即发生的为急性毒性；长期用药后产生的为慢性毒性；高敏性的病人或肝、肾有病而药物代谢或排泄功能不全，给予常用量也可出现毒性。毒性作用多是药理作用的延伸，大都可预知，临床用药应严格注意剂量和用药时间，严密观察，避免发生毒性反应。有些药物还具有致畸或致癌作用，也应重视。

(3) 变态反应：是指少数过敏体质病人对药物发生的病理性免疫反应。一般药物本身不具抗原性，而有些药物具有半抗原性，本身能叠聚成大分子或与体内高分子蛋白质结合形成完全抗原，从而引起变态反应。其特点是：①这种反应的发生与药物剂量无关或关系甚少；②不同药物可以出现类似症状，如荨麻疹、药疹、药热、哮喘、血管神经性水肿等，甚至出现过敏性休克，剥脱性皮炎；③这种反应不易预知，常见于反复用药，一旦产生此种反应，再用此药必然再度出现且多严重。对于可致变态反应的药物，用药前认真询问过敏史或进行过敏试验，有过敏史者或皮试阳性反应者应当禁用。

(4) 特异质反应：大多数是由于个体生化机制异常所致，与遗传有关，是一种遗传性生化缺陷。例如，红细胞缺乏葡萄糖6—磷酸脱氢酶（G-6-PD），是一种遗传性生化缺陷症，该患者进食蚕豆或服用治疗量的伯氨喹啉、奎宁、磺胺药、阿斯匹林等易产生高铁血红蛋白血症或溶血性贫血。

二、药物剂量—效应关系

药物剂量—效应关系简称量效关系，是指在一定范围内，同一药物的剂量（或浓度）增加或减少，药物效应也相应地增强或减弱。超过一定范围，就可能发生毒性反应。

1、剂量的概念：剂量就是用药分量。根据量效关系的规律和临床用药的情况，可分为无效量、最小有效量、常用量、极量、最小中毒量和致死量（图3—1）。

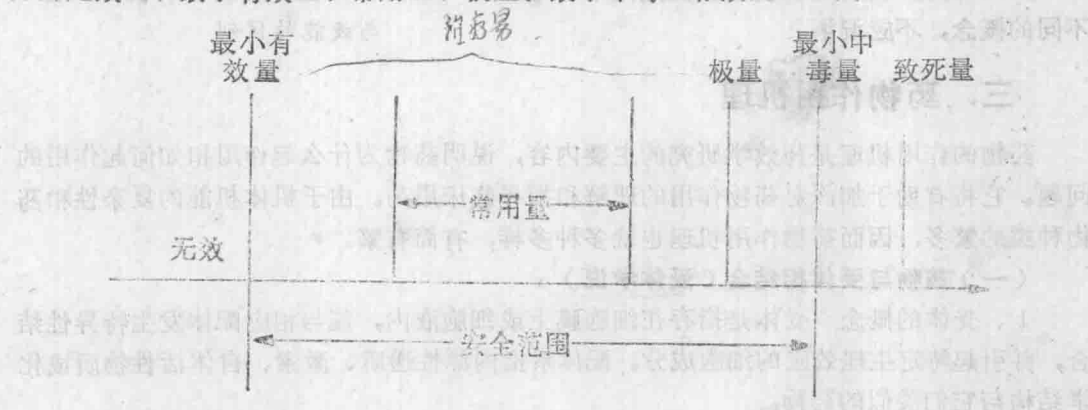


图3—1 药物剂量示意图

无效量：药物剂量不能使机体出现效应称无效量。

最小有效量：又称最小治疗量或阈剂量，即开始能使机体出现效应时的药量。

极量：即最大有效量或最大治疗量。超过极量可引起中毒。我国药典对剧、毒药规定了极量。超过剂量出现医疗事故，医护人员负有法律责任。

治疗量：指最小有效量和极量之间的量。但临床常采用常用量，即比最小有效量大，比极量小的剂量。药典和药书都明确规定了药物的常用量。

最小中毒量和致死量：超过极量，刚刚引起中毒的剂量称最小中毒量，超过中毒量而引起死亡的剂量称致死量。

安全范围和治疗指数：最小有效量与最小中毒量之间的距离称安全范围。距离愈大愈安全。

在动物实验中，测定引起半数动物死亡的剂量，即半数致死量 (LD_{50})，作为药物毒性的指标。用同样方法，规定疗效指标测定半数有效量 (ED_{50})。治疗指数是半数致死量与半数有效量的比值，即 LD_{50}/ED_{50} ，一般说，治疗指数大，药物安全范围就大，反之则小。

2、剂量——效应曲线：量效关系可以图解说明。以纵坐标表示效应强度，横坐标表示对数剂量。由此可以得到一条几乎是对称的S型曲线（图3—2）。当药物达到最小有效量时，开始出现效应，随着剂量（或浓度）增大效应逐渐增强，达到最大效应时，再加大剂量，效应也不会再增加。

3、强度与效能：“强度”是指产生一定效应的剂量比，亦称“效价”。例如，氢氯噻嗪0.1g与氯噻嗪1g产生同等的排钠利尿效应，可以认为前者比后者强10倍。“效能”是指药物的最大效应，即药物产生最大效应的能力。效能是药物本身的固有性质。例如，速尿的排钠利尿强度比氢氯噻嗪弱，但速尿的效能比氢氯噻嗪强。

由此可见，药物的强度与效能是两个不同的概念，不应混淆。

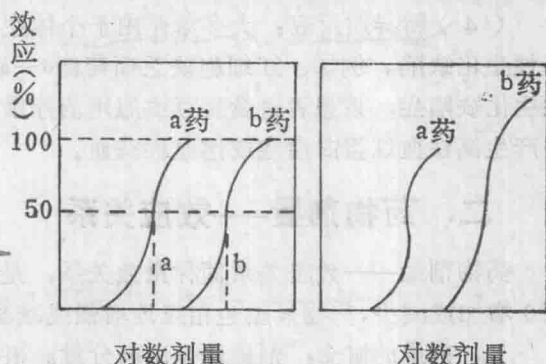


图3—2 对数剂量—效应曲线表示强度与效能的区别

三、药物作用机理

药物的作用机理是药效学研究的主要内容，说明药物为什么起作用 and 如何起作用的问题。它将有助于加深对药物作用的理解和指导临床用药。由于机体机能的复杂性和药物种类的繁多，因而药物作用机理也就多种多样，有简有繁。

（一）药物与受体相结合（受体学说）

1、受体的概念 受体是指存在细胞膜上或细胞液内，能与相应配体发生特异性结合，并引起特定生理效应的细胞成分。配体系指内源性递质、激素、自体活性物质或化学结构与它们类似的药物。

2、药物与受体结合 现在一般公认，大多数药物通过与受体相结合而发挥作用。受体的分子上只有某些活性基团能和药物结合，叫做受点。药物与受点多数是以离子键、氢键或分子间引力相结合，因而是可逆的，作用短暂；少数药物与受体是以共价键结合，形成稳定的复合物，常是不可逆的，效应强而持久。药物与受体结合具有下列特点：

①特异性：药物与受体都有严格的化学结构要求，一定结构的药物只能与其结构相

激动药
有激动性

吻合的受体结合, 结合比例较高, 与细胞其它成分结合很少或无。

②亲和力: 亲和力是指药物与受体结合的能力。亲和力大则结合多, 药物在极低浓度时也能与相应受体结合, 药物活性越高, 所需有效浓度越小; 亲和力小则结合少。

③药物与受体结合产生效应取决于药物的内在活性: 内在活性又称效应力, 是药物与受体结成复合物时, 激活受体引起生理效应的能力。若一药与受体有较大的亲和力, 也有较强的内在活性, 能激活受体产生效应, 该药称为该受体的激动药或兴奋药; 若某药与受体亲和力大而无内在活性, 与受体结合后不能激活受体产生效应, 反而竞争性拮抗激动药与受体结合, 对抗激动药作用, 称拮抗药或阻断药。另一类药物虽有较强亲和力, 但只有微弱的内在活性, 只能引起较弱的效应, 如有激动药存在时则可以拮抗其效应, 称部分激动药。

拮抗药有竞争性拮抗药和非竞争性拮抗药。前者与激动药相互竞争与相同受体结合; 后者不与激动药争夺相同受体, 但与受体结合后能改变效应器的反应性。

(二) 药物作用的非受体机理

1、改变理化条件 药物改变组织或细胞周围环境的理化条件。例如, 抗酸药中和胃酸治疗溃疡病; 甘露醇提高血浆渗透压, 使脑组织脱水, 用于脑水肿。

2、参与机体代谢过程 某些药物属机体正常代谢所需物质, 及时补充其在体内的不足或缺乏, 即可纠正其缺乏症, 如维生素B₁治疗脚气病; 某些药物的化学结构类似正常代谢物, 干扰机体某种代谢过程而发生作用, 如5-氟尿嘧啶的抗恶性肿瘤作用。

3、影响细胞膜的离子转运 局部麻醉药抑制钠离子通道, 阻碍钠离子内流, 从而阻断神经冲动的传导, 产生局麻效应。

4、影响酶的活性 新斯的明抑制胆碱酯酶活性, 使乙酰胆碱水解减少产生拟胆碱作用; 有些药物促进酶的活性, 如胰岛素促进己糖激酶的活性。

5、影响神经递质的释放 神经冲动在突触的传递是依靠递质来实现的。麻黄碱除直接与有关受体结合外, 还能促进肾上腺素能神经释放递质; 利血平耗竭肾上腺素能神经递质, 影响神经冲动的传递, 出现降低动脉血压的效应。

总之药物作用与效应是既有区别而又互相通用的概念, 它的基本表现是兴奋作用或抑制作用, 并具有选择性、二重性的规律。多数药物通过与受体结合形成可逆性复合物而产生效应, 少数药物则通过其它原理。药物作用的规律与受体学说对临床用药具有一定的指导意义。

复习思考题

- 1、何谓药物作用和药物效应? 药物作用的选择性有何意义?
- 2、怎样减少和避免药物的不良反应?
- 3、药物剂量与效应间的关系如何? 从量效关系曲线怎样理解药物常用量和极量、效能与强度的概念?
- 4、什么是受体? 怎样用受体学说来说明药物作用机理?

(衡阳市卫校 阙克清)