中等职业教育国家规划教材
全国中等职业教育教材审定委员会审定

药 物 学 基 础

（护理专业）

主　　编　鹿怀兴
副 主 编　彭丽红
责任主审　赵士斌（哈尔滨医科大学）
审　　稿　董德利　乔国芬（哈尔滨医科大学）

编 者（以姓氏笔画排列）
毕重国（首都铁路卫生学校）
李慧秀（湖南省岳阳市科技职业学院）
罗来源（三峡大学护理学院）
胡淑华（重庆医科大学卫生学校）
高忠贤（山东省滨州职业学院）
鹿怀兴（山东省滨州职业学院）
彭丽红（河北省廊坊市卫生学校）
董其庆（河北省唐山市职业技术学院）

高等教育出版社

需要全本请访问 www.ertongbook.com

郑 重 声 明

高等教育出版社依法对本书享有专有出版权。任何未经许可的复制、销售行为均违反《中华人民共和国著作权法》。行为人将承担相应的民事责任和行政责任，构成犯罪的，将被依法追究刑事责任。社会各界人士如发现上述侵权行为，希望及时举报，本社将奖励举报有功人员。

现公布举报电话及通讯地址：

电　　话：(010)84043279　13801081108

传　　真：(010)64033424

E - mail：dd@hep.com.cn

地　　址：北京市东城区沙滩后街 55 号

邮　　编：100009

责任编辑　席　雁

封面设计　于文燕

责任绘图　黄健英

版式设计　王艳红

责任校对　殷　然

责任印制

内容提要

本书是中等职业教育护理专业教材，依据2001年教育部颁布的《中等职业学校护理专业教学指导方案》中主干专业课程‘药物学基础教学基本要求’编写。

全书共18章，在保持药物学系统性的基础上，重点介绍了国家基本药物，适时反映学科的新进展、新概念、新技术及新药的发展，并在教材每章后设有处方及医嘱示例。药物学实验部分帮助学生理解、掌握相关理论知识和实验技能。附录中介绍了注射给药引起注射部位的特征性改变、药物对粪便和尿液颜色的影响等内容，以便使学生能具有适应临床的能力。

本书除可作为中等职业学校护理专业的专业课教材外，还可供在职医护人员参考阅读。

图书在版编目(CIP)数据

药物学基础／鹿怀兴主编. —北京：高等教育出版社，2003.2

中等职业教育国家规划教材

ISBN 7-04-011712-6

Ⅰ.药… Ⅱ.鹿… Ⅲ.药物学-专业学校-教材 Ⅳ.R9

中国版本图书馆CIP数据核字(2003)第110785号

出版发行 高等教育出版社
社　　址 北京市东城区沙滩后街55号
邮政编码 100009
传　　真 010-64014048

购书热线 010-64054588
免费咨询 800-810-0598
网　　址 http://www.hep.edu.cn
http://www.hep.com.cn

经　　销 新华书店北京发行所
印　　刷

开　　本 787×1092 1/16
印　　张 11.25
字　　数 260 000

版　　次 2003年 月第1版
印　　次 年 月第 次印刷
定　　价 13.80元

本书如有缺页、倒页、脱页等质量问题，请到所购图书销售部门联系调换。

版权所有 侵权必究

中等职业教育国家规划教材出版说明

为了贯彻《中共中央国务院关于深化教育改革全面推进素质教育的决定》精神，落实《面向21世纪教育振兴行动计划》中提出的职业教育课程改革和教材建设规划，根据教育部关于《中等职业教育国家规划教材申报、立项及管理意见》（教职成[2001]1号）的精神，我们组织力量对实现中等职业教育培养目标和保证基本教学规格起保障作用的德育课程、文化基础课程、专业技术基础课程和80个重点建设专业主干课程的教材进行了规划和编写，从2001年秋季开学起，国家规划教材将陆续提供给各类中等职业学校选用。

国家规划教材是根据教育部最新颁布的德育课程、文化基础课程、专业技术基础课程和80个重点建设专业主干课程的教学大纲（课程教学基本要求）编写，并经全国中等职业教育教材审定委员会审定。新教材全面贯彻素质教育思想，从社会发展对高素质劳动者和中初级专门人才需要的实际出发，注重对学生的创新精神和实践能力的培养。新教材在理论体系、组织结构和阐述方法等方面均作了一些新的尝试。新教材实行一纲多本，努力为教材选用提供比较和选择，满足不同学制、不同专业和不同办学条件的教学需要。

希望各地、各部门积极推广和选用国家规划教材，并在使用过程中，注意总结经验，及时提出修改意见和建议，使之不断完善和提高。

教育部职业教育与成人教育司

二〇〇一年十月

前　言

本教材依据教育部颁布的《中等职业学校护理专业教学指导方案》中主干专业课程“药物学基础教学基本要求”编写。

本教材本着拓宽基础、重视实践、方便教学的原则，力求体现药物的基本知识、基本理论，重点药物详细论述，常用药物概括论述，突出药物的不良反应、防治措施和注意事项。体现护理专业的用药特点，为临床合理用药提供必要的理论依据。

本教材在保持药物学系统性基础上，重点介绍了国家基本药物，适时反映学科的新进展、新概念、新技术及新药的发展。将护理程序在药物学中的运用，药物治疗中的常用护理诊断及其相关因素进行了论述。在每章后设有处方及医嘱示例；附录中介绍了注射给药引起注射部位的特征性改变、药物对粪便和尿液颜色的影响等内容，以便使学生能具有适应实际临床的能力。

全书共十八章，其中基础理论部分按照“了解”、“理解”、“掌握”三个层次要求编写，选修部分可根据各地实际进行教学或作为自学内容；实践内容分两部分：一是学生动手部分；二是通过电化教学手段完成部分。对学生要求是“会”、“掌握”和“熟练掌握”。

学时分配表（供参考）

章次	教学内容	学时数		
		理论	实践	合计
1	概论	6	4	10
2	抗微生物药	8	2	10
3	抗寄生虫病药	1		1
4	抗肿瘤药物	2		2
5	传出神经系统药物	6	2	8
6	麻醉药	1		1
7	中枢神经系统药物	7	1	8
8	抗变态反应药物	1		1
9	消化系统药物	2		2
10	呼吸系统药物	2		2
11	子宫收缩及舒张药	1		1
12	泌尿系统药物	2		2
13	心血管系统药物	6	1	7
14	血液和造血系统药物	3		3
15	激素类和有关药物	4		4
16	特效解毒药	1		1
17	药品知识及处方简介	1		1
18	药品治疗中常用护理诊断及其相关因素	0.5		0.5
机动		1.5	2	3.5
总计		57	12	68

需要全本请访问 www.ertongbook.com

参加本书编写的有鹿怀兴(第一、五章)、彭丽红(第二、十八章)、李慧秀(第三、九、十、十七章)、董其庆(第四、十三章)、胡淑华(第六、八章)、罗来源(第七章)、毕重国(第十一、十二、十四、十五、十六章)、高忠贤(药物学实验),鹿怀兴担任主编,彭丽红担任副主编。哈尔滨医科大学赵士斌教授担任责任主审,董德利讲师、乔国芬教授审稿。在教材编写过程中,得到了高等教育出版社和山东滨州职业学院及编者单位的大力支持和帮助,在此一并表示衷心的感谢。

由于我们水平所限,经验不足,编写中难免会出现缺点错误,恳望广大读者给予批评指正。

编者

2002 年 8 月

目　录

第一章　概论 …… (1)
第一节　概述 …… (1)
第二节　护理用药的基本原理 …… (4)
第三节　给药方案的拟定与执行 …… (9)
思考题 …… (13)

第二章　抗微生物药 …… (14)
第一节　概述 …… (14)
第二节　β-内酰胺类抗生素 …… (14)
第三节　大环内酯类、林可霉素类抗生素 …… (19)
第四节　氨基苷类抗生素和多黏菌素 E … (20)
第五节　四环素类抗生素和氯霉素 …… (22)
第六节　合成抗菌药及小檗碱 …… (24)
第七节　抗真菌药和抗病毒药 …… (27)
第八节　抗结核病药和抗麻风病药 …… (29)
第九节　医院常用消毒药 …… (32)
思考题 …… (35)

第三章　抗寄生虫病药 …… (36)
第一节　抗滴虫病药 …… (36)
第二节　抗疟药 …… (37)
第三节　抗阿米巴病药 …… (39)
第四节　抗血吸虫病药及抗丝虫病药 …… (40)
第五节　驱肠虫药 …… (40)
思考题 …… (41)

第四章　抗肿瘤药物 …… (42)
第一节　概述 …… (42)
第二节　常用的抗恶性肿瘤药 …… (43)
思考题 …… (46)

第五章　传出神经系统药物 …… (47)
第一节　概述 …… (47)
第二节　拟胆碱药和胆碱酯酶抑制剂 …… (49)
第三节　抗胆碱药和胆碱酯酶复活药 …… (51)
第四节　传出神经系统药物在治疗休克中的应用 …… (54)
思考题 …… (58)

第六章　麻醉药 …… (59)
第一节　局部麻醉药 …… (59)
第二节　全身麻醉药 …… (61)
思考题 …… (63)

第七章　中枢神经系统药物 …… (64)
第一节　中枢神经兴奋药 …… (64)
第二节　抗焦虑药和镇静催眠药 …… (66)
第三节　抗癫痫药 …… (69)
第四节　抗精神失常药 …… (72)
第五节　抗震颤麻痹药 …… (75)
第六节　镇痛药 …… (77)
第七节　解热镇痛抗炎药 …… (80)
思考题 …… (83)

第八章　抗变态反应药物 …… (85)
第一节　组胺和抗组胺药 …… (85)
第二节　钙盐 …… (86)
思考题 …… (87)

第九章　消化系统药物 …… (88)
第一节　常用助消化药 …… (88)
第二节　抗消化性溃疡药 …… (88)
第三节　止吐药及胃肠促动力药 …… (90)
第四节　泻药与止泻药 …… (91)
第五节　治疗肝性脑病药 …… (92)
思考题 …… (93)

第十章　呼吸系统药物 …… (94)
第一节　镇咳药 …… (94)

第二节　祛痰药 ……（95）
第三节　平喘药 ……（95）
思考题 ……（98）

第十一章　子宫收缩及舒张药 ……（99）
第一节　子宫收缩药 ……（99）
第二节　子宫舒张药 ……（100）
思考题 ……（101）

第十二章　泌尿系统药物 ……（102）
第一节　利尿药 ……（102）
第二节　脱水药 ……（105）
思考题 ……（106）

第十三章　心血管系统药物 ……（107）
第一节　抗高血压药 ……（107）
第二节　抗慢性心力衰竭药 ……（112）
第三节　抗心律失常药 ……（115）
第四节　抗心绞痛药 ……（119）
思考题 ……（121）

第十四章　血液和造血系统药物 ……（123）
第一节　促凝血药(止血药) ……（123）
第二节　抗凝血药及溶栓药 ……（124）
第三节　抗贫血药 ……（125）
第四节　血容量扩充药 ……（126）
第五节　盐类和酸碱平衡调节药 ……（127）
第六节　促进白细胞生成药 ……（129）
思考题 ……（130）

第十五章　激素类和有关药物 ……（131）
第一节　肾上腺皮质激素类药物 ……（131）
第二节　甲状腺激素和抗甲状腺药及降钙素 ……（134）
第三节　胰岛素及口服降血糖药 ……（136）
第四节　性激素及抗性激素药 ……（138）
第五节　避孕药 ……（142）
思考题 ……（143）

第十六章　特效解毒药 ……（145）
第一节　有机磷酸酯类急性中毒解毒药 ……（145）
第二节　氰化物急性中毒解毒药 ……（145）
第三节　金属和类金属中毒解毒药 ……（146）
第四节　其他常用解毒药 ……（146）
思考题 ……（147）

第十七章　药品知识与处方简介 ……（148）
思考题 ……（152）

第十八章　药物治疗中常用护理诊断及其相关因素 ……（153）
思考题 ……（154）

药物学实验 ……（155）
实验一　药物的局部作用和吸收作用 …（155）
实验二　药物剂量对药物作用的影响 …（155）
实验三　静脉给药速度对药物作用的影响 ……（156）
实验四　简单制剂的调配操作练习 ……（156）
实验五　药物的配伍禁忌 ……（157）
实验六　链霉素的毒性反应及钙剂的对抗作用 ……（157）
实验七　传出神经系统药物对动物瞳孔的影响 ……（158）
实验八　传出神经系统药物对动物血压的影响(录像) ……（159）
实验九　有机磷酸酯类急性中毒及其解救 ……（159）
实验十　地西泮的抗惊厥作用 ……（160）
实验十一　氯丙嗪的药理与临床(录像) ……（160）
实验十二　尼可刹米对呼吸抑制的解救 ……（161）
实验十三　常用降压药的药理与临床(录像) ……（161）
实验十四　糖皮质激素的不良反应与护理(讨论) ……（162）
实验十五　模拟执行处方、医嘱的药物调配 ……（162）

附录一　药物对粪便、尿液颜色的影响 ……（164）

附录二　静脉给药对局部组织的影响及其处理 …… (165)

附录三　常用实验动物的捉拿和给药方法 …… (166)

第一章 概 论

第一节 概 述

一、药物和药物学的概念

药物是指能影响机体(或病原体)生理生化功能,用于预防、治疗、诊断疾病或计划生育的化学物质。根据其来源可分为天然药物和人工合成药物两大类。药物学是一门研究药物的作用、临床应用,不良反应和注意事项为主要内容的科学。

古代人们在与疾病斗争过程中了发现了药物,并逐渐积累了用药防治疾病的经验,其中有不少流传至今,例如大黄导泻、麻黄止喘及柳皮退热等。中国最早的一部本草书是《神农本草经》,著于公元一世纪前后,收载药物 365 种,是世界上第一部药物学著作。此后,历代对本草都有新的增补,例如公元 659 年由唐朝政府颁布的《新修本草》,是我国最早的一部药典,也是世界上最早的一部药典。明朝伟大的医药学家李时珍编著的《本草纲目》,收载药物 1 892 种,对药物的生态、功能和应用等均有详细记述,另附插图 1 160 幅,药方 11 000 余条。这部著作不仅促进了我国医药学的发展,而且还先后译成德、日、法、朝、英、俄、拉丁等 7 种文字传播到世界各地,对世界医学发展做出了巨大贡献。

从 19 世纪开始,化学、生理学以及生物化学等学科的发展和新技术的应用,对药物学的发展起了积极推动作用,而 20 世纪是药物学高速发展的世纪,各国的医药工作者为此都做出了巨大的贡献。我国的医药工作者也开展了卓有成效的工作,特别是在发掘祖国医学遗产和新药方面取得了巨大成就。例如从延胡索中提出并能人工合成的镇痛药罗通定 ;中药麻醉药洋金花 ;从唐古特山莨菪中提取并用人工合成的山莨菪碱 ;从防己科植物中提出的多种肌松药 ;抗冠心病药毛冬青、丹参、葛根及川芎等。对化学合成药物的研究,也取得了可喜的成绩。同时对药物的作用机制从深度和广度方面进行了深入研究。在深度方面由器官和细胞水平深入到分子水平 ;在广度方面,出现了如临床药理学、精神药理学、生化药理学、免疫药理学以及遗传药理学等边缘学科。

尽管我国对药物的研究、药物生产有了较大进展,对人民的健康事业起了积极推动作用,但与世界先进水平相比尚有差距,为此,要求全体医药工作者奋发图强,学习先进科学技术,为振兴我国的医药事业,为保障人类的健康而奋发努力。

二、护理程序在药物治疗中的应用

护理程序是一种科学地确认问题和解决问题的工作方法,是一个综合的、动态的、具有决策和反馈功能的过程,护理程序在药物治疗中的运用是通过一系列有目的、有计划的、有系统的动

态护理工作，针对病人现有的或潜在的健康需要，给予有效的预防和治疗，使其达到最佳的健康状态。护理程序包括护理评估、护理诊断、护理计划、实施计划和护理评价。

（一）护理评估

护理评估是护士有组织、有计划、连续地收集护理对象一些资料的过程。在药物治疗中，护理人员系统地收集整理与护理对象有关的用药资料，其内容主要有：①既往病史和现病史：如既往健康状况和目前健康状况，年龄、性别、文化程度、饮食、睡眠、排便、排尿情况、活动能力、心理及精神状态等。②估计用药史：常用或曾用何种药物，有无用药禁忌证，是否对药物有依赖性，有无药物过敏史等。③护理对象及家属对相关药物的了解程度，如药物作用、用途、用法、不良反应及注意事项等。

（二）护理诊断

护理诊断是护理人员对病人潜在的或现存的疾病过程的一种临床诊断，常见的与用药有关的护理诊断由两部分组成，即诊断名称和相关因素。如潜在并发症与药物不良反应有关；焦虑与患者对疾病和药物缺乏知识有关等。

（三）护理计划

护理计划主要有两方面的内容：一是确定预期目标，即护理人员要帮助病人达到的健康目标。二是护理措施，即协助病人预防、减轻和消除健康问题反应的措施。与药物治疗、预防或不良反应有关的内容有：护理人员如何准确执行用药医嘱，对药物疗效的观察，可能出现哪些不良反应，怎样防治（监护）、有效的健康及康复教育等。

（四）实施计划

实施计划是护理程序中的重要步骤，护士应将制定的实施计划付诸实践，确保计划的落实。在实施计划中，要随时书写护理记录，继续收集资料，并注意对病人的再评估，要及时检查并修订护理计划，充分注意病人用药安全和观察病人的用药反应，并随时进行调整。

（五）护理评价

护理评价是护理程序中最后一步，护理人员通过以上护理程序，依据实施后的结果，评价是否达到了预期目标，同时要求护理人员在护理过程中应随时进行评价，对预期目标实施以后要进行综合分析，并及时修订和调整护理计划。

与用药有关的评价内容是对用药以后的预期效果进行评价，如应用抗心绞痛药护理评价的内容是：是否胸闷、有无绞痛、有无心慌，血压有无下降等，药物及剂量是否需要调整，病人对抗心绞痛药知识掌握多少等。

三、护理程序在药物治疗中的运用示例——护理程序在利尿药中的应用

（一）用药前的护理评估

1. 病史评估　根据利尿药治疗中可能产生的不良反应评估患者病史，如有无心血管疾病，有无肝、肾、肺、脑功能不良疾患等；有无血尿及水肿的类型；肾区检查情况等。

2. 用药史评估　是否用过利尿药；何时因何原因应用；有无耳毒反应；曾用过何种药物及发生过哪些不良反应等。

3. 病人情绪评估　是否烦躁，对药物治疗、手术治疗或放疗的态度。

4. 其他评估　现有疾病症状和体征，实验室检查和其他检查项目，可能引起利尿药并发症

需要全本请访问 www.ertongbook.com

的诱因，患者及家属对利尿药的认识等。

（二）护理诊断

1. 潜在并发症　与水、电解质紊乱和利尿药应用过量有关。

2. 感知功能改变　与长期大量应用高效能利尿药的毒性有关。

3. 焦虑　与利尿过程的心理压力和情绪紧张有关。

4. 疼痛　与高效、中效利尿药导致痛风引起的关节痛有关。

5. 自我形象改变　与利尿药引起外观变化有关。

6. 知识缺乏　缺乏利尿药及其应用效果的有关知识。

（三）护理计划

1. 目标：

（1）无水、电解质紊乱。

（2）耳毒性损伤极少发生。

（3）情绪稳定，焦虑减轻。

（4）较少发生痛风症状。

（5）能熟悉利尿药引起的尿液变化。

（6）能叙述利尿药的作用、不良反应及预防措施。

2. 护理措施

（1）应用高效能利尿药前，注意检测听力情况，并密切观察用药后反应，避免和易损伤听神经的药物如氨基苷类联用。

（2）应用利尿药过程中要注意适时补充电解质，尤其注意监测血钾水平，以防水、电解质紊乱。

（3）注意检测病人尿酸盐水平，预防痛风的发生。

（4）利尿药应用时间一般上午为主，以确保患者夜间睡眠不受夜尿干扰。

（5）告诉病人应用利尿药可能引起的不良反应，如有出现应及时报告医护人员。

（6）针对不同病因，应用相应的抗生素以防感染。

（7）作好记录　记录从应用利尿药开始到作用消失期间病人发生的各种药物反应及处理措施。

（8）教育计划　告诉病人利尿药的作用和可能发生的反应及处理措施。

（四）实施护理计划

将上述计划中各项护理措施逐项落实。

（五）护理评价

1. 电解质是否平衡。

2. 有无严重药物不良反应发生。

3. 焦虑是否减轻，睡眠是否正常。

4. 有无意外伤害的情况。

5. 能否叙述利尿药的有关知识。

第二节　护理用药的基本原理

一、药物的作用

（一）药物的基本作用和药物的作用类型

1. 药物的基本作用　指机体在药物影响下所发生的反应，其基本表现为兴奋和抑制。能使机体原有功能活动增强者称为兴奋作用，如肾上腺素使心肌收缩力增强，呋塞米使尿量增多等。能使机体原有功能活动减弱的作用称抑制作用，如普萘洛尔使心率减慢，地西泮（安定）的镇静催眠作用等。

2. 药物的作用类型

1）局部作用和吸收作用　药物进入血液循环之前，在用药局部所产生的作用称局部作用。如口服抗酸药物中和胃酸作用 碘酊对皮肤的消毒作用等。药物随血流分布到机体各组织器官所呈现的作用称吸收作用，也称全身作用，如阿司匹林产生的解热作用。

2）选择作用　药物在治疗剂量时，常常选择性地对机体的一个或几个组织、器官产生明显的作用，而对其他组织、器官作用很小或无作用，称为药物的选择作用。如强心苷对心肌的兴奋作用。药物选择作用是相对的，常与应用的剂量有关，当剂量增大时，其作用范围也扩大。如咖啡因对大脑皮层有兴奋作用，大剂量应用时也会兴奋延脑和脊髓，甚至引起惊厥。因此，临床用药时应注意掌握药物的剂量。

3）防治作用和不良反应

（1）防治作用　可分为预防作用和治疗作用。

① 预防作用　是指在疾病和症状或出现之前用药所发生的作用。

② 治疗作用　是以治疗疾病为目的，能达到治疗效果的作用。治疗作用可分为对因治疗和对症治疗。凡能消除致病因素的治疗称对因治疗，如大叶性肺炎病人应用青霉素杀灭体内致病菌。凡能改善疾病症状的治疗称为对症治疗，如小儿高热惊厥注射地西泮等。对症治疗虽不能消除病因，但能改善症状解除病人痛苦，如高热、休克情况下，应及时对症治疗，以防病情恶化，也为对因治疗赢得时间，此时对症治疗比对因治疗更重要。

（2）不良反应　与用药目的无关，用药后对机体产生不利或有害的反应，统称不良反应。

① 副反应　药物在治疗剂量时出现的与治疗目的无关的反应（通常也称副作用）。副作用一般危害不大，可预知，但难以避免。治疗作用与副作用可随用药目的不同而相互转化。如麻黄碱治哮喘时所致失眠为其副作用，而麻黄碱消除苯海拉明引起的嗜睡，此时的中枢兴奋作用是治疗作用。

② 毒性反应　多因用药剂量过大或用药时间过长或病人对药物的敏感性过高而引起的对机体的危害性反应。毒性反应一般比较重，可以预知，应尽量避免。毒性反应若是在用药后立即发生，称为急性毒性反应；由于长期用药，药物在体内蓄积后逐渐产生的毒性反应称为亚急性毒性反应或慢性毒性反应。常见的毒性反应有中枢神经系统反应、造血系统反应、心血管系统反应以及肝、肾损害等。静脉注射或滴注过快、配伍不当或给药途径错误也可致毒性反应，应引起高度重视。此外，药物致癌、致畸、致突变反应亦属于毒性反应范畴。

③ 后遗效应　指停药后血浆药物浓度降至最小有效浓度以下时残存的药理效应。如服用苯巴比妥镇静催眠,次晨呈困倦,乏力、头昏现象。

④ 变态反应　是指少数过敏体质病人对某些药物产生的病理性免疫反应,亦称过敏反应。其发生与用药剂量无关。常见有皮疹、药热、哮喘、血管神经性水肿以及严重的致过敏性休克等。对易致变态反应的药物在用药前应询问过敏史,做皮肤过敏试验,有药物过敏史或皮试阳性者应禁用。但皮试仍有少数假阴性反应,应予注意。

⑤ 继发反应　指药物治疗作用后产生的不良后果,如长期应用广谱抗生素后,由于体内的敏感菌被抑制或杀灭,不敏感菌大量繁殖,导致菌群失调引起新的感染发生。

⑥ 特异质反应　指少数有遗传性生化缺陷的病人对某些药物产生的异常反应。如红细胞内缺乏葡萄糖－6－磷酸－脱氢酶的病人,食用蚕豆类制品、磺胺类药物后易产生急性溶血性贫血。

⑦ 药物依赖性　分为精神依赖性和身体依赖性。精神依赖是指病人精神上对药物产生的依赖性,停药后出现主观不适感,渴望再次用药,以求获得满足。易产生精神依赖性的药物称为“精神药品”,如咖啡因等。身体依赖性则是病人从生理上产生了对药物的依赖,一旦停药产生戒断症状。表现为流涎、流泪、流鼻涕、出汗、思睡、烦躁不安、腹痛及惊厥等。易产生身体依赖性的药物也称‘麻醉药品”,如吗啡及哌替啶等 。

（二）药物的作用机制

药物作用机制是解释药物如何起作用和为什么产生作用的问题。了解药物作用机制,可以加深对药物作用和不良反应的理解,从而为合理用药,做好用药监护提供理论依据。

1. 受体学说的基本概念

(1) 受体与配体　受体是一类功能蛋白质,能识别周围环境中某种微量化学物质并与之结合,通过中介的信息放大系统,引起细胞的生理反应或药理效应。体内能与受体特异性结合的物质称为配体。如神经递质、激素、自身活性物质和化学结构与之相似的药物。受体和配体有高度亲和力,多数配体在很低浓度时即可引起细胞的生物效应。

(2) 药物与受体结合　药物与受体的结合是可逆的,而且具有特异性。药物与受体结合并产生效应,应有两个条件。一是亲和力,即药物与受体结合的能力;二是内在活性,即药物激活受体产生效应的能力。据此将与受体结合的药物分为 3 类。①受体激动剂　指药物与受体既有亲合力,又有内在活性,能激动受体产生效应,如去甲肾上腺素激动 α 受体,引起血管收缩,血压升高。②受体阻断药　指药物对受体只有亲和力,而无内在活性,不能激活受体产生效应,阻断激动药与受体结合,产生与受体激动药相反的效应。如酚妥拉明阻断 α 受体,竞争性地阻断去甲肾上腺素与 α 受体结合呈现血管扩张,血压下降。③受体部分激动剂　指药物与受体具有较强的亲和力,但仅有微弱的内在活性。当单独应用时引起较弱的激动效应;当有激动药存在时,则产生抗激动药的作用。故这类药物具有激动药和拮抗药两种特性。如喷他佐辛(镇痛新)即属受体部分激动药。

2. 其他作用机制　药物还能通过改变细胞周围的理化环境,影响递质的体内代谢过程,影响生物膜的功能和改变酶的活性等方式产生作用。

二、药物的体内过程

药物的体内过程即药物的处置过程，包括药物的吸收、分布、生物转化和排泄过程。

（一）药物的吸收和影响因素

药物从给药部位进入血液循环的过程称吸收。药物吸收的快慢和多少直接影响药物作用的速度和程度。影响药物吸收的因素有：

1. 给药途径：

给药途径对药物吸收的快慢及多少有明显影响。除静脉注射外，其他给药途径吸收的快慢依次为吸入＞舌下＞肌内注射＞皮下注射＞口服＞直肠皮肤给药。

（1）口服　口服给药影响作用的因素有以下几方面：胃肠 pH、服药时间、胃内容物的多少、胃排空速度和胃肠蠕动及有些药物被胃肠道吸收，经门静脉进入肝，并被转化灭活，使进入体循环的药量减少，药效降低而产生的首过消除等。

（2）皮下和肌内注射　受注射部位血流量的影响，皮下注射吸收的速度较肌内注射慢。

（3）舌下含服及直肠给药　这两种给药途径都是经黏膜下毛细血管吸收入血，且没有首过消除，故吸收速度较快，疗效好。

2. 药物方面

（1）药物的理化性质　对药物吸收有一定影响，小分子、脂溶性高和极性小的药物易通过细胞膜，吸收入血。如弱酸性药物在酸性环境中解离度小，脂溶性高，易吸收入血。反之，弱酸性药在弱碱性环境下，则难以吸收。

（2）药物制剂与生物利用度　同一药物制剂（如地高辛），由于各药厂的制剂工艺不同，甚至同一厂生产的相同制剂，只是生产批号不同，其生物利用度也有一定差异，应予注意。

生物利用度是药物被机体吸收利用的程度。它与药物作用的强度和速度有关。一般以口服吸收百分比表示。

$$\text{生物利用度} = \frac{\text{实际吸收药量}}{\text{服药总量}} \times 100\%$$

（二）药物的分布和影响因素

药物分布指药物随血液循环向组织器官的转运过程。药物在各组织器官的分布往往是不均匀的，其影响因素有：

1. 与血浆蛋白的结合　不同的药物与血浆蛋白有不同程度的可逆性结合，结合型药物因分子增大不能通过生物膜，暂且失去活性，不被代谢和排泄。只有游离型药物才能进行转运，产生药理作用。与血浆蛋白结合率高的药物，起效慢，作用弱，作用维持时间相对延长。游离型药物浓度低时，结合型药物开始解离，二者保持动态平衡。同时当两种血浆蛋白结合率高的药物联合应用时，可发生竞争性与血浆蛋白结合的现象，从而将另一种药物从蛋白结合部位置换下来，使其游离浓度增高，作用和毒性均增强。如双香豆素和保泰松合用，保泰松就会与双香豆素竞争和血浆蛋白的结合，使血浆游离型双香豆素增高，抗凝作用增强。

2. 体液 pH　生理情况下，人体内各种体液的 pH 是不同的，血液和细胞外液 pH 为 7.4，细胞内液 pH 为 7.0 。因此，弱酸性药物在细胞外液分布高于细胞内液；弱碱性药物则相反。

3. 药物与组织的亲和力　有些药物与某些组织有特殊的亲和力。如碘主要分布在甲状腺

中。

4. 特殊屏障　体内有各种屏障可影响药物吸收，主要有血－脑脊液屏障及胎盘屏障等。

血－脑脊液屏障（简称血脑屏障）　是指血液、脑脊液和脑细胞之间隔膜的总称。许多大分子、极性高的药物及与血浆蛋白结合的药物，均不易透过血脑屏障。炎症时，可以增加血脑屏障的通透性，如青霉素用于脑膜炎治疗即属之。

胎盘屏障　是由胎盘将母体与胎儿血液隔开的屏障。脂溶性高的药物易通过胎盘进入胎儿血液，故孕妇用药应谨慎。

（三）药物的生物转化和影响因素

药物的生物转化是指药物结构被机体所改变的化学过程。药物经转化后，大部分变为无药理活性的代谢产物排出体外，这是药物自机体消除的重要途径之一。也有的药物在体内不被代谢而以原型从肾脏排出。药物的生物转化是在肝药酶的催化下进行，分为两个步骤：一是药物的氧化、还原和水解；二是与体内某些物质（如葡萄糖醛酸和硫酸等）结合过程，形成极性高，药理活性低或无活性的物质排出体外。有些药物可增强肝药酶活性或促进肝药酶合成，称为药酶诱导剂，如苯妥英钠，利福平等。而能抑制或减弱药酶活性，减慢药物代谢的药物，称药酶抑制剂，如氯霉素、异烟肼及保泰松等。

（四）药物的排泄和影响因素

排泄是指体内药物最后以代谢产物或原形的形式被排出体外的过程。排泄的主要器官是肾脏，其次是消化管、胆道、呼吸道、汗腺及乳腺等。

1. 肾脏排泄　药物及代谢产物经肾脏的排泄主要经过三种形式：肾小球滤过、肾小管分泌和肾小管再吸收。肾小球的通透性较大，除了较大分子的物质和与血浆蛋白结合的药物外，游离型药物及其代谢产物均可经肾小球滤过。滤过后肾小管有不同程度的再吸收。吸收的多少，主要取决于尿液的酸碱度和药物的脂溶性。脂溶性药物容易再吸收，但排泄速度也慢；水溶性药物再吸收少，排泄则快。

尿量和尿液 pH 也影响药物排泄。尿量增加可使尿液药物浓度降低、减少再吸收，从而增加药物排泄。尿液 pH 对药物排泄也有影响，弱酸性药物在碱性尿中解离型增多，再吸收减少，排泄加快。有的药物可改变尿液颜色，如维生素 B_2、利福平分别使尿液呈黄色和橘红色。

2. 胆汁排泄　某些药物由肝脏分泌至胆管，再随胆汁排入小肠，然后随粪便排出。有些药物在肠中可部分被再吸收，形成“肝肠循环”，使药物排泄减慢，作用时间延长。

（五）药物的消除和蓄积

药物经过在体内的分布、生物转化和排泄使血浆药物浓度降低的过程，称为药物的消除。消除的类型有两种：

1. 一级消除动力学　指在单位时间内药物按恒定的比值消除，又称恒比消除。多数药物属此类消除。

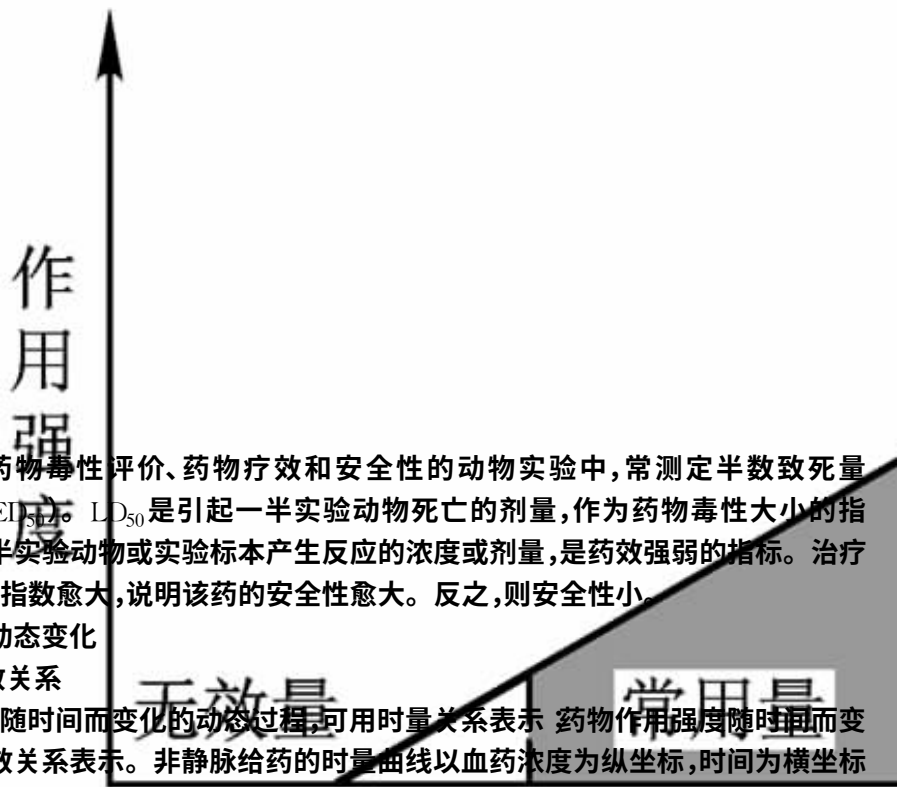
2. 零级消除动力学　指药物在单位时间内按恒定的数量进行消除，又称恒量消除。当用药量过大时，血药浓度超过机体恒比消除能力的极限时进行恒量消除，而后进行恒比消除。

当反复多次给药时，药物进入体内的速度超过消除速度，血药浓度不断升高，称为药物的蓄积。临床用药时，可利用药物的适当蓄积，以达到和维持有效血浓度。但药物蓄积量过大，会引起中毒，应予注意。

三、给药与血药浓度的动态变化

（一）药物剂量与效应的关系

1. 量效关系　剂量是指用药的分量。剂量大小决定药物在体内浓度的高低，与药物效应关系密切。在一定范围内，剂量越大，作用越强，超过一定范围就会发生中毒，甚至死亡。药物剂量过小，不能引起药理作用，称为“无效量”；能引起药理效应的最小剂量称为最小有效量；随着剂量的增加，作用随之明显增强，允许使用的最高剂量称为极量；最小有效量和极量之间的剂量为治疗量；为使药效可靠，用药安全，临床上常采用比最小有效量大些而比极量小些的剂量，称为常用量；超过极量，血药浓度继续升高，引起毒性反应的最小剂量，称最小中毒量。剂量与药物作用关系（图 1－1）。



2. 治疗指数　在药物毒性评价、药物疗效和安全性的动物实验中，常测定半数致死量（LD_{50}）和半数有效量（ED_{50}）。LD_{50}是引起一半实验动物死亡的剂量，作为药物毒性大小的指标；ED_{50}是指能引起一半实验动物或实验标本产生反应的浓度或剂量，是药效强弱的指标。治疗指数 $= LD_{50}/ED_{50}$，治疗指数愈大，说明该药的安全性愈大。反之，则安全性小。

（二）血药浓度的动态变化

1. 时量关系和时效关系

研究血浆药物浓度随时间而变化的动态过程，可用时量关系表示；药物作用强度随时间而变化的动态过程，可用时效关系表示。非静脉给药的时量曲线以血药浓度为纵坐标，时间为横坐标作图，而得时量关系曲线。（图 1－2）。

2. 血浆半衰期、稳态血浓度及其意义

血浆半衰期（$t_{1/2}$）是指药物在血浆中的浓度下降一半所需的时间。血浆半衰期反映了药物在体内的消除速度。由于多数药物按恒比消除方式而进行消除，其半衰期是固定的。据此，为了维持药物在体内的有效浓度，可按半衰期长短决定给药次数。同时也可预测连续用药时血药浓度达到相对稳定的时间，以及停药后药物消除的时间。一般隔一个半衰期重复恒量给药一次，经过 5 个半衰期后，血药浓度就基本达到一个相对稳定的水平，此时药物的吸收与消除几乎相等，故称稳态血浓度，又称为坪值。（图 1－3）。

需要全本请访问 www.ertongbook.com