

前言

自《药理学基础》（第1版）于2018年6月问世以来，我们有幸见证了它在职业教育领域的卓越成就，包括荣获“十三五”“十四五”职业教育国家规划教材和首届全国教材建设奖全国优秀教材一等奖。随着我国医药卫生健康事业的迅猛发展，药物治疗技术及药事管理法规也在不断地优化更新。为了更好地贯彻党的二十大精神，实施科教兴国、人才强国、创新驱动发展战略，全面推进教育强国建设，落实立德树人根本任务，紧密对接健康中国国家战略需求，服务高质量卫生职业教育体系，科学出版社携手全国卫生职业院校骨干教师和卫生行业企业专家，依据教育部最新《职业教育专业教学标准2025年修（制）订》和课程标准，参考《中国药典》（2025年版）和疾病治疗新指南、药物治疗新技术、药事管理新规范，对原有教材进行了全面的修订改版。

本教材坚持以习近平新时代中国特色社会主义思想为指导，遵循中职学生身心发展规律、卫生职业教育规律和人才成长规律，对接岗位需求、国家执业药师资格考试标准和“1+X”证书要求，坚持以人民健康为中心，围绕“职业能力”这一核心，以“药物的作用、用途、不良反应”为主线，采用案例导入、问题导向、任务驱动的教学模式，融药理学知识传授、用药技能培育和社会主义核心价值观养成为一体，注重培养学生分析问题与解决问题的职业能力，以及工匠精神和医者仁心。

在内容上，本教材分为10个基本理论项目和14个实训任务，渗透健康中国理念，将药学发展的新技术、新工艺、护理用药新理念纳入教材内容，更好适应岗位需求。同时，教材还插入了知识链接、案例分析、医者仁心等模块，对接国家护士执业资格考试，融入以人民健康为中心的药物治疗理念，配套“中科云教育”平台丰富的数字化教学资源，以强化学生能力培养，服务学生发展，提升学生综合素质。

此外，本教材辅以《药理学基础》国家在线精品课程配有的教学课件、图片、微课视频、动画、案例解析、题库等丰富的数字教学资源并持续更新，使教材更具情景化、动态化、数字化、形象化，充分体现卫生职业新形态教材特色和岗位适应性，满足线上线下混合式教学改革需求，较好地体现了数字化新形态教材创新理念。全书内容容易学易懂，构思新颖，图文并茂，方便教学。

在教材编写过程中，我们参考了大量有关药物治疗方面的文献，在此向原作者及出版社表示衷心感谢。同时，教材编写得到了科学出版社的精心指导及各位编者所在单位的大力支持，在此一并感谢。由于编写时间仓促，加之编者水平有限，教材中可能存在疏漏与不妥之处，恳请专家学者及广大读者批评指正，以便进一步修订完善。

符秀华

2025年2月

配套资源

欢迎登录“中科云教育”平台，**免费**数字化课程等你来！

本教材配有图片、视频、音频、动画、题库、PPT 课件等数字化资源，持续更新，欢迎选用！

“中科云教育”平台数字化课程登录路径

电脑端

- 第一步：打开网址 <http://www.coursegate.cn/short/LEX4T.action>
- 第二步：注册、登录
- 第三步：点击上方导航栏“课程”，在右侧搜索栏搜索对应课程，开始学习

手机端

- 第一步：打开微信“扫一扫”，扫描下方二维码



- 第二步：注册、登录
- 第三步：用微信扫描上方二维码，进入课程，开始学习

PPT 课件：请在数字化课程各章节里下载！

目 录

项目一 药理学基本理论与用药技能·····1

任务1 认识药物和药理学·····1

任务2 药物对机体的作用——
药效学·····3

任务3 机体对药物的影响——
药动学·····9

任务4 影响药物作用的因素·····19

任务5 药品知识与用药技能·····26

项目二 传出神经系统药物·····36

任务1 认识传出神经系统药物·····36

任务2 胆碱受体激动药和胆碱
酯酶抑制药·····40

任务3 胆碱受体阻断药·····44

任务4 肾上腺素受体激动药·····49

任务5 肾上腺素受体阻断药·····55

任务6 抗变态反应药·····59

项目三 中枢神经系统药物·····65

任务1 镇静催眠药·····65

任务2 抗癫痫药·····69

任务3 抗帕金森病药·····72

任务4 抗精神障碍药·····74

任务5 镇痛药·····79

任务6 解热镇痛药·····84

任务7 中枢兴奋药·····87

任务8 麻醉药·····89

项目四 呼吸系统药物·····97

任务1 镇咳药·····97

任务2 祛痰药·····98

任务3 平喘药·····100

项目五 消化系统药物·····106

任务1 助消化药、增强胃肠
动力药与止吐药·····106

任务2 抗消化性溃疡药·····108

任务3 泻药与止泻药·····113

项目六 泌尿、生殖系统药物·····118

任务1 利尿药·····118

任务2 脱水药·····121

任务3 调节水电解质与酸碱
平衡药·····122

任务4 子宫平滑肌兴奋药与
抑制药·····126

项目七 心血管系统药物·····131

任务1 抗高血压药·····131

任务2 抗心绞痛药·····143

任务3 抗心力衰竭药·····147

任务4 抗心律失常药·····153

任务5 调血脂药·····157

项目八 血液与造血系统药物·····165

任务1 抗贫血药·····165

任务2 促凝血药、抗凝血药
和溶栓药·····167

任务3 血容量扩充药·····173

项目九 内分泌系统药物·····176

任务1 肾上腺皮质激素类药·····176

任务2 甲状腺激素和抗甲
状腺药·····180

任务 3 胰岛素和口服降 血糖药	184	的影响	237
任务 4 性激素类药	190	实训 5 药物体外配伍禁忌	238
项目十 抗微生物、抗寄生虫、 抗肿瘤药物	193	实训 6 毛果芸香碱与阿托品 对家兔瞳孔的影响	239
任务 1 抗微生物药基本理论	193	实训 7 青霉素过敏性休克的 抢救及用药护理	239
任务 2 抗生素	196	实训 8 磺胺类药物的溶解性	240
任务 3 人工合成的抗菌药	207	实训 9 氨基糖苷类药物的用药 护理	242
任务 4 抗结核药	212	实训 10 有机磷酸酯类中毒及 解救	242
任务 5 抗真菌药与抗病毒药	215	实训 11 抗高血压药的用药 护理	243
任务 6 消毒防腐药	220	实训 12 硝酸甘油的抗心绞痛 作用	244
任务 7 抗寄生虫病药	222	实训 13 糖皮质激素类药物的 用药护理	245
任务 8 抗肿瘤药	226	实训 14 糖尿病患者的用药 护理	246
实训	234	参考文献	248
实训 1 常用实验动物的捉拿 方法与给药方法	234	自测题参考答案	249
实训 2 药品说明书的临床应用	236		
实训 3 给药剂量对药物作用 的影响	237		
实训 4 给药途径对药物作用			

药理学基本理论与用药技能

任务1 认识药物和药理学

一、药物和药理学概念

药物是指能影响机体的生理生化功能，可用于预防、诊断和治疗疾病的化学物质。而药品则是指用于预防、治疗、诊断人的疾病，有目的地调节人的生理功能并规定有适应证或者功能主治、用法和用量的物质，包括中药、化学药和生物制品等。

药物是人们战胜疾病、维护健康的重要武器，对各种疾病的预防及治疗都起着十分重要的作用。而药物又是把“双刃剑”。合理用药可防治疾病；但若用之不当，会产生不良反应而危害健康。为了加强药品管理，保证药品质量，保障公众的用药安全和合法权益，保护和促进公众健康，国家制定颁布了《中华人民共和国药品管理法》（以下简称《药品管理法》），在中华人民共和国境内从事药品研制、生产、经营、使用和监督管理活动均应严格依法执行。

药理学是研究药物与机体（包括病原体）相互作用及其规律的学科，其研究内容包括药物效应动力学（简称药效学）和药物代谢动力学（简称药动学）（图1-1）。

1. 药效学 主要研究药物对机体的作用及作用机制，以阐明药物防治疾病的规律，包括药物的作用、作用机制、临床用途及不良反应等。

2. 药动学 主要研究机体对药物处置的动态变化过程，包括药物在机体内的吸收、分布、代谢及排泄四个过程，以及血药浓度随时间变化的规律等。

药效学和药动学这两个过程在体内是同时进行的，并且有着密切的联系，其研究的侧重点不同。前者侧重于研究药物对机体的作用，后者侧重于研究机体对药物的处置过程。其共同目的在于为临床合理用药提供科学依据，以充分发挥药物的防治效果，尽可能减少药物不良反应的发生。

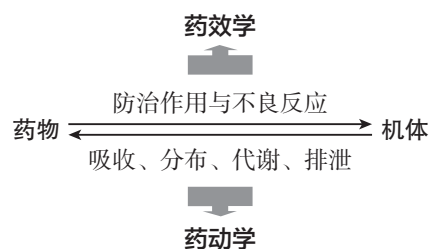


图 1-1 药效学与药动学示意图

二、药理学的任务和目标

药理学基础作为中等职业教育医药卫生大类各专业重要的基础（或核心）课程，旨在为学生提供临床工作中所必需的药理学基本知识和技能。该课程是连接基础医学与临

床课程的桥梁,对于培养学生正确、合理、安全地使用药物,以及提高医疗护理质量、确保患者用药安全具有重要意义。通过学习药理学基础,学生将掌握药物的分类、作用、临床用途、不良反应及药物相互作用等核心知识,为后续的专业核心课程如内科护理、外科护理等课程的学习奠定坚实的基础。

(一) 课程任务

1. 系统介绍药理学的基本理论、基本概念和基本知识,包括药物的分类、性质、作用机制、药动学、药效学及常用药物的临床用途等。
2. 通过案例分析、实践操作等环节,培养学生的药物识别能力、药物配伍禁忌判断能力、药物剂量计算能力、药物不良反应监测及处理能力,以及运用药理学知识解决不合理用药问题的能力。
3. 强化学生的职业道德观念,使其认识合理用药的重要性,树立以患者健康为中心的服务理念,培养敬佑生命、救死扶伤的职业精神和信息素养。

(二) 课程目标

1. 知识目标
 - (1) 理解药理学的基本概念、原理和方法。
 - (2) 掌握临床常用药物的作用、应用、不良反应及注意事项。
 - (3) 了解药物的最新研究进展和临床应用指南。
2. 能力目标
 - (1) 具备观察、监测患者用药反应,及时发现并处理药物不良反应的能力。
 - (2) 能够进行药物的配制、给药操作,确保用药安全。
 - (3) 能够在医疗护理工作中灵活运用药理学知识,进行个体化用药指导,提高医疗护理质量。
3. 素养目标
 - (1) 树立敬佑生命、救死扶伤的职业精神,以高度的责任心对待每一位患者。
 - (2) 培养良好的信息素养,能够主动获取、分析、利用药理学相关信息,为临床决策提供依据。
 - (3) 强化团队合作精神,与医疗团队其他成员密切配合,共同为患者提供全面、优质的医疗护理服务。

三、用药护理工作流程

护士作为药物治疗的直接执行者,始终处于临床第一线,是临床用药的守关人,在治疗过程中,应以患者的健康为中心,严格遵守用药工作流程,以确保临床用药科学规范、安全有效(表1-1)。

表 1-1 用药护理工作流程

时间	任务	主要内容
给药前	评估患者	病情、用药目的、用药史、过敏史等
	核对医嘱	药名、浓度、剂量、给药途径、给药时间等
	核查药品	外观、批号，阅读说明书、配伍禁忌等
给药中	遵照医嘱给药	严格遵守“三查八对一注意”制度（图 1-2）、准确执行医嘱
	安全用药指导	向患者及家属讲解用药注意事项等
给药后	评估治疗效果	仔细观察治疗前后患者症状、体征、化验结果等变化
	监测不良反应	加强观察，包括生理和心理反应，及早发现并记录药物的不良反应，及时处理

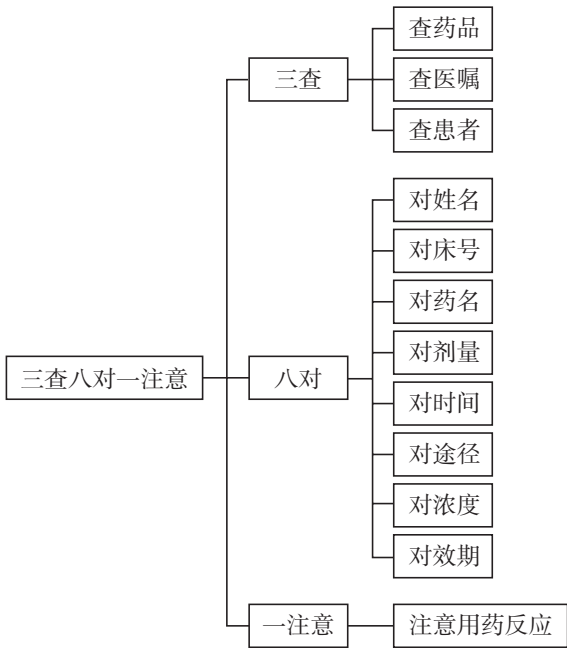


图 1-2 护理用药“三查八对一注意”示意图

操作前：查药品、查医嘱、查患者，确保基础信息准确。操作中：再次核对药品和患者信息，确保操作无误。
操作后：观察患者反应，确保操作安全

任务 2 药物对机体的作用——药效学

案例 1-1

患者，男，60 岁。患有高血压多年，近期因心绞痛频繁发作而入院治疗。医嘱给予硝酸甘油静脉滴注，以缓解心绞痛症状。在硝酸甘油静脉滴注开始后约 5 分钟，患者突然感到头痛剧烈，伴有恶心、呕吐，心率加快至 120 次 / 分，血压下降至 90/60mmHg（1mmHg=0.133kPa）。

问题：1. 患者用药后出现上述症状可能的原因是什么？

2. 在治疗过程中，应如何做好用药护理，以避免类似不良反应的发生？

一、药物的基本作用

药物的基本作用是指药物对机体原有功能活动的影响，包括兴奋作用和抑制作用。兴奋作用是指凡能使机体原有功能活动增强的作用，如肾上腺素增强心肌收缩力、尼可

刹米使呼吸加快等均属于兴奋作用。抑制作用则是指凡能使机体原有功能活动减弱的作用，如普萘洛尔减慢心率、阿托品减少腺体分泌等均属于抑制作用。

二、药物作用的主要类型

（一）局部作用和吸收作用

1. 局部作用 指药物在用药局部产生的作用。例如，普鲁卡因在其浸润部位产生的局部麻醉作用。

2. 吸收作用 指药物进入血液循环后产生的作用，又称全身作用。例如，吸入麻醉药通过肺部吸收，使中枢神经受到抑制而产生全身麻醉作用。

（二）直接作用和间接作用

1. 直接作用 指进入机体的药物对器官、组织直接产生的作用。例如，洋地黄毒苷可直接兴奋心脏心肌细胞，加强心肌的收缩力。

2. 间接作用 指药物对机体产生某种直接作用而引起的继发性作用，又称继发作用。例如，洋地黄毒苷产生强心作用而继发的利尿作用。

（三）选择作用和普遍细胞作用

1. 选择作用 指药物对机体不同器官、组织的作用表现出明显差异的现象。例如，缩宫素对子宫平滑肌有很强的收缩作用，而对其他平滑肌基本无作用。药物的选择作用是临床选药的基础，也是药物分类的依据。通常药物的选择性越高，针对性越强，疗效越好；反之，选择性低的药物，则作用广泛，不良反应较多。药物的选择性是相对的，随着剂量的增加，其作用范围逐渐扩大，而选择性逐渐降低。例如，咖啡因小剂量能选择性兴奋大脑皮质而振奋精神；较大剂量可兴奋延髓呼吸中枢抢救呼吸衰竭；若剂量过大则广泛兴奋中枢神经系统引起惊厥等不良反应。

2. 普遍细胞作用 指药物对各种组织细胞都呈现出类似的影响，不具有明显的选择性。这类药物通常影响细胞的普遍生理过程，如细胞的代谢、增殖等，因此可能对多种组织或器官产生影响。

（四）防治作用和不良反应

药物是把“双刃剑”，在发挥防治作用的同时，也可能产生不良反应，此为药物作用的两重性。这种两重性体现了药物作用的复杂性，是药物治疗中需要仔细权衡的一个重要方面。在为患者选择用药的过程中，应充分发挥药物的防治作用，预防或减少不良反应的发生，以促进患者早日康复。

1. 防治作用 指符合用药目的能达到防治疾病效果的作用，包括预防作用和治疗作用。

（1）预防作用 指在疾病发生之前使用药物，以降低疾病发生的风险或阻止疾病的传播。例如，接种疫苗来预防某些传染病，或使用某些药物来预防特定条件下可能发生的疾病。

（2）治疗作用 指对已经发生的疾病进行治疗，以达到控制病情、缓解症状、消除

病因或促进康复的目的。治疗作用可以进一步分为对因治疗和对症治疗。

1) 对因治疗：指针对疾病的根本原因进行治疗，目的是彻底消除疾病或阻止疾病的发展。例如，抗生素用于治疗细菌感染，通过杀死或抑制细菌生长来治疗疾病。

2) 对症治疗：指针对疾病的症状进行治疗，目的是缓解患者的不适感，改善患者的生活质量。例如，使用退热药降低发热患者的体温，或使用镇痛药缓解疼痛。

对因治疗可以根治疾病，是临床药物治疗的关键，也称治本。对症治疗仅能改善疾病的症状或减轻患者痛苦，称为治标。对症治疗虽不能根治疾病，但在高热、休克等危急情况下，挽救患者的生命是当务之急，应根据患者的具体情况，积极采取对症治疗措施，防止病情进一步恶化，为对因治疗争取时间，降低病死率。因此，临床用药时应根据患者的具体情况，遵循“急则治其标，缓则治其本，标本兼治”的原则，正确处理对症治疗和对因治疗的关系。

2. 不良反应 指与用药目的无关，为患者带来不适或痛苦的反应。常与药物作用、机体或遗传、连续用药等有关，包括副作用、毒性反应、后遗效应、继发反应、变态反应、特异质反应、耐受性与耐药性、药物依赖性等（图 1-3）。

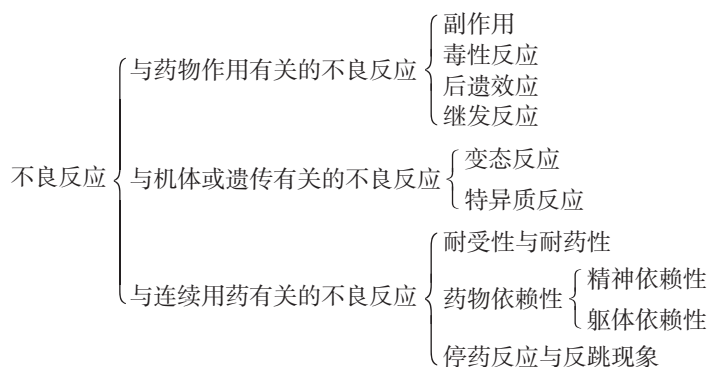


图 1-3 药物不良反应类型

（1）副作用 指正常剂量情况下出现的与用药目的无关的反应，又称副反应。即药物在正常用法、用量情况下，伴随其治疗作用而出现的其他不期望产生的作用。例如，苯海拉明抗过敏时，可能引起嗜睡、口干等副作用；硝苯地平治疗高血压时，可能引起面部潮红、头痛、下肢水肿和便秘等副作用。

副作用是药物固有的作用，多数较轻微并可以预知。其产生的原因主要是药物选择性低。随着用药目的不同，治疗作用与副作用可以相互转化。当药物某一作用作为治疗目的时，其他作用就成为药物的副作用。例如，阿托品用于治疗胃肠道绞痛时，其松弛胃肠道平滑肌作用为治疗作用，抑制腺体分泌引起的口干为副作用。而当阿托品用于麻醉前给药时，抑制腺体分泌的作用为治疗作用，松弛胃肠道平滑肌引起的腹胀则为副作用。医务人员应提前告诉患者药物可能出现的副作用，以避免患者出现恐慌情绪。

（2）毒性反应 指由于药物剂量过大、用药时间过长，或者机体对药物的敏感性过高而导致的对机体有明显损害的不良反应。这些反应可能对患者的健康造成严重威胁，

甚至危及生命。例如，地高辛应用剂量过大，血药浓度过高，可能导致心脏毒性，引起心律失常；长期使用阿司匹林可能引起胃肠道出血、溃疡，甚至穿孔等。

1) 急性毒性反应和慢性毒性反应：急性毒性反应是指在短时间内大量用药后迅速发生的毒性反应，可能影响循环系统、呼吸系统、神经系统等，需要立即医疗干预。慢性毒性反应是指长期用药导致药物在体内蓄积，逐渐出现的毒性反应。这种反应可能损害肝脏、肾脏、骨髓、内分泌系统等器官功能。某些药物也可能因为代谢慢或排泄不畅而在体内累积，长期使用后可能引起慢性毒性。

2) 三致作用：指药物或化学物质可能引起的三种严重的不良反应，包括致癌作用、致畸作用和致突变作用。这些反应对人类健康构成重大威胁，通常在药物研发和评估过程中被严格审查。

由于“三致作用”的严重性，新药上市前要经过严格的安全性评估，如急性毒性试验、长期毒性试验、临床试验等，以确保药物的安全性和有效性，减少患者在使用药物过程中的风险。此外，药物说明书通常会包含有关潜在致癌、致畸和致突变风险的警告，以指导医疗专业人员和患者合理使用药物。

链接

药物史上的悲剧——“沙利度胺”事件

20 世纪 50 年代，德国研制开发的沙利度胺（反应停）作为镇静催眠药上市，因该药能够显著抑制孕妇的妊娠反应，曾作为一种“没有任何副作用的抗妊娠反应药物”风靡欧洲，成为“孕妇的理想选择”。但许多孕妇应用该药后产下了手脚发育畸形、形同海豹的“海豹儿”，累计多达 1.2 万余名，这一震惊世界的典型的药物致畸事件，被称为“沙利度胺”事件（也称“反应停”事件），是 20 世纪最大的药物灾难。

（3）变态反应 指药物引起的免疫反应，包括免疫学中的各种免疫反应，其反应性质与药物原有效应无关，又称过敏反应。例如，青霉素类抗生素可导致荨麻疹、血管性水肿，甚至过敏性休克；磺胺类药物可能引起皮疹、发热、关节痛，以及在罕见情况下的严重溶血性贫血等。

变态反应产生原因为免疫系统错误地将药物成分识别为外来威胁，并产生特异性抗体或细胞介导的免疫反应，与过敏体质有关，而与用药剂量无关，且临床不易预知。其严重性和表现形式多样，轻者会出现皮疹、药物热、神经血管性水肿等，严重者会导致过敏性休克，甚至危及生命。因此在用药前要详细询问药物过敏史，避免应用已知过敏的药物。对于轻微的变态反应，可应用抗组胺药物对症治疗；对于严重的变态反应，如过敏性休克，需要紧急医疗干预。

由于变态反应可能迅速恶化，甚至危及生命，医务人员和患者都必须对药物过敏反应保持高度警觉。患者应记录自己的药物过敏史，并在每次就医时告知医务人员。

（4）继发反应 指药物治疗作用之后出现的不良反应，是治疗剂量下治疗作用本身带来的后果，又称治疗矛盾。这些反应通常是药物的药理作用导致的间接效果，而不是

药物本身的直接毒性。例如，当广谱抗生素抑制或杀死敏感细菌时，可能会打破正常菌群平衡，导致不敏感的细菌或真菌过度生长，引起新的感染，如念珠菌感染。

(5) 后遗效应 指停用某药物后血药浓度已降至阈浓度以下时仍残存的药物效应。例如，长期使用巴比妥类药物，即使停药，患者仍可能会在次日感到困倦、反应迟钝等，也称为“宿醉反应”。

(6) 停药反应 指长期使用某些药物，突然停药使原有疾病症状迅速重现或加重的现象，又称反跳现象。例如，长期使用抗癫痫药后突然停药可能导致癫痫发作的频率和严重程度增加，甚至诱发癫痫持续状态。

(7) 特异质反应 指使用某些药物后出现的一些与药物本身药理作用无关，也和一般人群不同的反应。这些反应的出现往往与先天性、遗传性因素等有关。例如，葡萄糖-6-磷酸脱氢酶（G6PD）缺乏的患者在使用伯氨喹等药物时，可能发生溶血性贫血。

(8) 耐受性与耐药性

1) 耐受性：指连续用药后药效递减，要增大剂量才可以产生疗效的现象。例如，长期使用阿片类药物（如吗啡、羟考酮）进行疼痛管理时，患者可能逐渐对药物产生耐受性，需要增加剂量才能获得相同的镇痛效果。

2) 耐药性：指病原体或肿瘤细胞对药物的敏感性或反应性降低甚至消失的现象，又称抗药性。例如，细菌对抗生素，如青霉素、四环素等产生耐药性，使得这些抗生素无法有效治疗感染。

耐药性的产生是一个全球性的公共卫生问题，需要通过合理使用药物、开发新药物、监测耐药性趋势，以及采取有效的感染控制措施来应对。医务人员和患者都应遵循适当的用药指南，以减少耐药性的产生。

(9) 药物依赖性 指长期或反复应用某种药物产生精神或躯体上的依赖，持续或周期地渴望重复应用该种药物的现象。药物依赖性可分为精神依赖性和躯体依赖性。

1) 精神依赖性：指药物使用者对药物在精神意识上产生的强烈渴求，以获得用药后的特殊快感或避免不适感，又称心理依赖性 or 习惯性。这种依赖性主要源于药物对中枢神经系统产生的特殊精神效应，如兴奋、激动及舒适感等。精神依赖性的产生与药物种类、使用方式及个体特性等因素密切相关。例如，长期饮酒可能导致个体对酒精产生精神依赖，出现难以控制的饮酒欲望；长期使用某些镇静催眠药物，如苯巴比妥类药物，可能引起患者对其睡眠改善效果产生心理依赖。

2) 躯体依赖性：指由于反复使用某类药物，机体对该类药物产生了生理上的适应状态，又称生理依赖性 or 成瘾性。药物产生躯体依赖性后，一旦停止使用，机体会出现一系列戒断症状，如恶心、呕吐、头痛、失眠等，严重者可危及生命。例如，长期使用吗啡等阿片类镇痛药可能导致躯体依赖性，停药时机体可能出现出汗、颤抖、恶心、呕吐、腹泻等戒断反应症状。药物躯体依赖者为求得继续用药以减轻痛苦，常不择手段，甚至丧失道德人格走向犯罪，对家庭和社会造成极大危害。

3) 麻醉药品和精神药品: ①麻醉药品是指连续使用后易产生躯体依赖性、能成瘾癖、列入麻醉药品目录的药品和其他物质。例如, 阿片类、可卡因类及大麻类等。②精神药品是指直接作用于中枢神经系统, 使之兴奋或者抑制, 连续使用能产生依赖性的药品。例如, 镇静催眠药、抗焦虑药、中枢兴奋药及致幻剂等。

考点 药物不良反应的类型及概念

三、药物的作用机制

药物的作用机制旨在探讨药物如何发挥作用及其背后的原理。深入了解这一机制, 能够更准确地把握药物的治疗效果及其潜在的不良反应, 为提高药物疗效、降低不良反应风险提供坚实的理论基础, 进而指导临床合理用药, 确保用药安全。药物种类繁多, 性质千差万别, 其作用机制也复杂多样, 可归纳为以下几个主要方面。

(一) 药物 - 受体作用机制

受体是细胞表面或细胞内能特异性识别生物活性物质(配体)并与之结合, 进而产生生物学效应的蛋白质。大多数药物的作用是通过与受体结合而呈现。药物与受体结合产生效应, 必须具备两个条件: ①药物与受体结合的能力, 即亲和力; ②药物与受体结合后, 激活受体产生特定药理效应的能力, 即内在活性。根据药物与受体结合情况, 将药物分为受体激动药和受体阻断药两类(表1-2)。

表 1-2 受体激动药与受体阻断药比较表

分类	亲和力	内在活性
受体激动药	较强	较强
受体部分激动药	较强	较弱
受体阻断药	较强	无

考点 受体激动药和受体阻断药的概念

1. 受体激动药 指能够特异性地与细胞表面或内部受体结合, 并激活这些受体产生生物学效应的药物, 又称受体激动剂。它们不仅具有亲和力, 还具备内在活性, 能与受体结合产生显著的生物学反应。例如, 毛果芸香碱作为一种M受体激动药, 能有效激活M受体, 从而展现出M样作用, 可用于治疗青光眼。

2. 受体阻断药 指能与细胞表面或内部特定受体结合, 阻止或减弱内源性配体或药物对受体激活效应的药物, 又称受体阻断剂。这类药物仅具有亲和力, 但不具备内在活性, 与受体结合后不会产生生物学效应, 而是起到拮抗激动剂作用的效果。以阿托品为例, 作为M受体阻断药, 它能与M受体紧密结合, 有效阻断乙酰胆碱对M受体的兴奋作用, 产生与乙酰胆碱相反的生物学效应, 如松弛内脏平滑肌等。

3. 受体部分激动药 指既能与受体结合, 又具有一定亲和力的药物, 这类药物在单独使用时有较弱的激动作用。而当这类药物与完全激动药合用时, 能对抗完全激动药的作用, 减弱完全激动药所产生的生物学效应。以阿片受体为例, 喷他佐辛作为阿片受体

的部分激动药，在单独使用时可能产生较弱的镇痛作用，但当与完全激动药如吗啡合用时，会显著减弱吗啡的镇痛效果。

（二）药物的其他作用机制

1. 改变理化环境 通过调整机体内环境的理化特性，药物能够产生显著的治疗效果。例如，快速静脉滴注20%甘露醇，通过提升血浆晶体渗透压，促使水从组织间液向血管内转移，从而达到脱水效果；抗酸药则通过中和胃酸，调节胃内pH，对消化性溃疡起到治疗作用。

2. 参与或影响机体的代谢过程 药物能够直接参与（或）调控机体的代谢途径，从而实现治疗目的。例如，胰岛素作为关键的代谢调节激素，参与糖代谢过程，降低血糖水平，广泛应用于糖尿病的治疗；铁制剂则通过促进血红蛋白的合成，有效缓解贫血症状。

3. 影响生物膜的通透性或离子通道 某些药物能够作用于细胞膜或细胞内的离子通道，改变其通透性，进而影响细胞的功能。例如，多黏菌素类药物通过增加细菌细胞膜的通透性，导致菌体成分外泄，达到杀菌效果；硝苯地平则通过阻滞血管平滑肌的 Ca^{2+} 通道，松弛血管平滑肌，达到降压目的。

4. 影响酶的活性 药物能够作为酶的抑制剂或激活剂，调节酶的活性，进而干扰或促进特定的生化反应。例如，磺胺类药物通过抑制细菌的二氢叶酸合成酶，干扰细菌叶酸的代谢，发挥抗菌作用；卡托普利则通过抑制血管紧张素Ⅰ转换酶的活性，减少血管紧张素Ⅱ的生成，从而降低血压。

5. 影响递质的释放或激素的分泌 药物能够影响神经递质或激素的释放与分泌，调节机体的生理功能。例如，麻黄碱通过促进去甲肾上腺素能神经末梢释放去甲肾上腺素，产生拟肾上腺素的作用；甲苯磺丁脲则通过刺激胰岛素的分泌，降低血糖水平。

6. 影响核酸的代谢 核酸是遗传信息的载体，药物通过干扰核酸的合成或功能，进而影响细胞的生长与分裂。例如，利福平能抑制细菌DNA转录合成RNA发挥抗结核作用。

7. 影响免疫功能 免疫功能是机体抵抗外来病原体入侵的重要防线。某些药物能够调节机体的免疫功能，增强或抑制免疫应答。例如，糖皮质激素类药物能够抑制机体的免疫功能，减少免疫细胞的数量和活性，从而减轻器官移植时的排斥反应。

任务3 机体对药物的影响——药动学

案例 1-2



患者，男，68岁。因长期咳嗽、低热、体重下降，诊断为活动性肺结核。根据其病情，医生拟采用异烟肼与利福平联合治疗方案进行抗结核治疗。在用药前医嘱检查肝肾功能。在治疗过程中，患者发现其痰液和尿液颜色逐渐变为橘红色，担心病情加重而产生焦虑。

问题：1. 在用药前为什么要检查肝肾功能？

2. 痰液和尿液颜色为什么变为橘红色？如何处理？

药物代谢动力学（简称药动学），是研究药物在机体内如何被处理，以及血药浓度随时间变化的科学。药物的体内过程，涵盖了药物在体内的四个核心环节：吸收、分布、代谢及排泄。这些环节共同决定了药物在体内的变化过程和治疗效果（图1-4）。

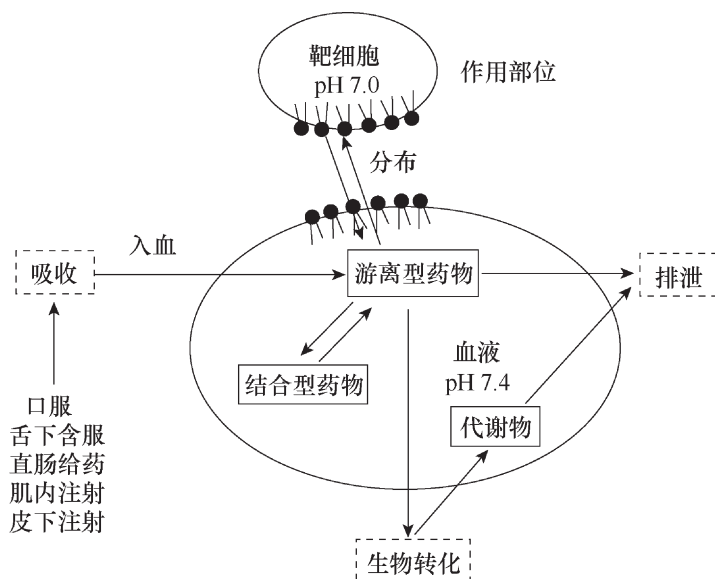


图 1-4 药物体内过程示意图

一、药物的体内过程

（一）药物的吸收

药物的吸收是指药物从给药部位进入血液循环的过程。药物吸收是药物治疗的第一步，也是药物发挥治疗作用的关键环节。而药物吸收是一个复杂的过程，受到多种因素的影响。在实际应用中，需要根据药物的特性和患者的具体情况选择合适的给药途径和

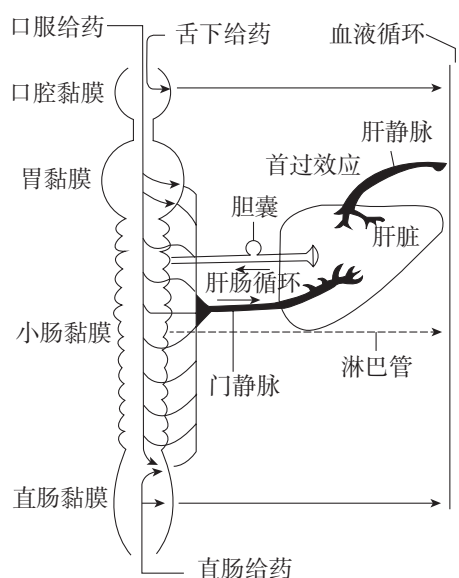


图 1-5 消化道给药的吸收过程及首过消除示意图

剂型，以确保药物的有效吸收和治疗效果。影响药物吸收的因素包括以下几种。

1. 给药途径和吸收部位

（1）消化道给药

1) 口服给药：是一种普遍、安全、便捷且经济的给药方式，但其药效显现较慢。药物通过食管和胃进入小肠，由于胃的吸收能力有限，大部分药物在小肠中被吸收。小肠具备较大吸收表面积、丰富的血流、缓慢的蠕动及接近中性的pH环境，使得药物在此处得到有效吸收。然而，部分药物在通过肠黏膜和肝脏时可能被代谢灭活，导致进入血液循环的药量减少，药效降低，这种现象称为首过消除，也称首过效应（图1-5）。对于首过消除明显的药物如硝酸甘油，其