



医药卫生类专业“互联网+”精品教材

# 药理学

YAOLIXUE

主 编 刘金义 李 融



扫描二维码  
共享立体资源

药理学

主  
编  
刘金义  
李 融



中南大学出版社  
www.csupress.com.cn



中南大学出版社  
www.csupress.com.cn

# 目录

## 第一篇 药理学总论

### 单元一 概论 1

### 单元二 药物效应动力学 5

任务一 药物作用的基本规律 6

任务二 药物剂量与效应关系 7

任务三 药物与受体 10

### 单元三 药物代谢动力学 12

任务一 药物的跨膜转运 13

任务二 药物的体内过程 13

任务三 药动学基本概念、参数及其意义 16

### 单元四 影响药物作用的因素 20

任务一 机体因素 21

任务二 药物因素 23

## 第二篇 外周神经系统药理

### 单元五 传出神经系统药理概论 27

任务一 传出神经系统的递质与分类 28

任务二 传出神经系统受体的类型及效应 29



任务三 传出神经系统药物作用的方式与药物分类 30

## 单元六 拟胆碱药和抗胆碱药 32

任务一 拟胆碱药 33

任务二 抗胆碱药 36

## 单元七 拟肾上腺素药和抗肾上腺素药 42

任务一 拟肾上腺素药 43

任务二 抗肾上腺素药 47

## 单元八 局部麻醉药 54

任务一 局部麻醉药的作用及其机制 55

任务二 局部麻醉药的应用方法 55

任务三 常用的局部麻醉药 56

## 第三篇

## 中枢神经系统药理

## 单元九 镇静催眠药 59

任务一 苯二氮䓬类 60

任务二 巴比妥类 61

任务三 其他镇静催眠药 63

## 单元十 抗癫痫药和抗惊厥药 65

任务一 抗癫痫药 66

任务二 抗惊厥药 68

## 单元十一 抗精神失常药 71

任务一 抗精神病药 72

任务二 抗躁狂症及抗抑郁症药 76



## 单元十二 镇痛药 80

- 任务一 阿片类镇痛药 81
- 任务二 人工合成镇痛药 83
- 任务三 其他镇痛药 85
- 任务四 阿片受体拮抗药 85

## 单元十三 解热镇痛抗炎药 88

- 任务一 解热镇痛抗炎药的基本作用 89
- 任务二 常用的解热镇痛抗炎药物 89
- 任务三 治疗痛风的药物 92

## 单元十四 中枢兴奋药 95

- 任务一 主要兴奋大脑皮质的药物 96
- 任务二 主要兴奋延髓呼吸中枢药 97
- 任务三 促大脑功能恢复药 97

### 第四篇

### 心血管系统药理

## 单元十五 抗心律失常药 100

- 任务一 抗心律失常药的分类 101
- 任务二 常用的抗心律失常药 101
- 任务三 抗快速型心律失常药的选用 106

## 单元十六 抗心绞痛药 109

- 任务一 硝酸酯类及亚硝酸酯类 110
- 任务二  $\beta$ 受体阻断药 112
- 任务三 钙通道阻滞药 112

## 单元十七 抗高血压药 115

- 任务一 抗高血压药物分类 116
- 任务二 常用抗高血压药 117
- 任务三 抗高血压联合用药原则 122



## 单元十八 抗慢性心功能不全药 125

任务一 正性肌力药 126

任务二 肾素-血管紧张素-醛固酮系统抑制药 129

任务三 减轻心脏负荷药 129

任务四  $\beta$ 受体阻断药 130

## 第五篇

## 血液系统与内脏器官系统药理

## 单元十九 影响血液及造血系统药物 133

任务一 抗贫血药 134

任务二 影响凝血过程药 136

任务三 血容量扩充剂 139

## 单元二十 利尿药及脱水药 143

任务一 利尿药 144

任务二 脱水药 147

## 单元二十一 作用于消化系统药物 150

任务一 助消化药 151

任务二 抗消化性溃疡药 151

任务三 止吐药与促胃肠动力药 155

任务四 泻药 157

任务五 止泻药 159

## 单元二十二 作用于呼吸系统药物 163

任务一 平喘药 164

任务二 镇咳药 167

任务三 祛痰药 168

## 单元二十三 组胺和抗组胺药 171

任务一 组胺 172

任务二 抗组胺药 172



## 单元二十四 子宫平滑肌兴奋药和抑制药 176

任务一 子宫平滑肌兴奋药 177

任务二 子宫平滑肌抑制药 179

## 第六篇

## 内分泌系统药理

## 单元二十五 肾上腺皮质激素类药物 181

任务一 糖皮质激素 182

任务二 盐皮质激素 185

## 单元二十六 甲状腺激素及抗甲状腺药 188

任务一 甲状腺激素 189

任务二 抗甲状腺药 190

## 单元二十七 胰岛素及口服降血糖药 195

任务一 胰岛素 196

任务二 口服降血糖药 197

## 第七篇

## 化学治疗药

## 单元二十八 抗菌药物概述 201

任务一 抗菌药物的基本概念 202

任务二 抗菌药物的作用机制 203

任务三 细菌的耐药性 203

任务四 抗菌药临床应用的基本原则 204

## 单元二十九 抗生素 207

任务一  $\beta$ -内酰胺类抗生素 208

任务二 大环内酯类、林可霉素类及其他类抗生素 213

任务三 氨基苷类及多黏菌素类抗生素 215

任务四 四环素类及氯霉素 217

任务五 其他类抗生素 219



### 单元三十 人工合成的抗菌药 224

任务一 喹诺酮类药物 225

任务二 磺胺类药物和甲氧苄啶 227

任务三 其他合成抗菌药 229

### 单元三十一 抗真菌药及抗病毒药 233

任务一 抗真菌药 234

任务二 抗病毒药 235

### 单元三十二 抗结核病药及抗麻风病药 241

任务一 抗结核病药 242

任务二 抗麻风病药 244

# 第一篇 药理学总论

## 单元一 概论

### 学习目标

1. 能说出药物、药理学、护理药理学的概念。
2. 会区分药物、毒物、食物的关系。
3. 护士具有在临床护理用药中的能力。

### 预习案例

小李是职业学院足球队队员，身强体壮。他向同学小张说他长这么大从没生过病，没有用过药。小张一听马上反驳说，就算你没生过病，但也有可能用过药。

思考

说说小李可能用过哪些药？



药品说明书包含内容

药物是指用于预防、治疗、诊断疾病和计划生育的化学物质，除诊断用药外，大多数药物能够影响机体的生理功能和（或）生化过程。毒物是指较小剂量即可产生毒性反应、损害机体健康的化学物质。绝大多数药物剂量过大时均可产生毒性反应，因此药物与毒物之间没有严格的界限，只有合理应用药物才能达到预期目的。

## 一、药理学及护理药理学的任务与性质

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机制的一门学科，是以生理学、生物化学、病理学等为基础，为临床合理用药、防治疾病提供基本理论的桥梁学科。其中，研究药物对机体的作用和作用机制，称药物效应动力学，简称药效学；研究机体对药物的处理过程及血药浓度随时间变化的关系，称药物代谢动力学，简称药动学。

药理学的基本任务是阐明药物对机体的作用及作用机制，同时也要阐明药物在机体内吸收、分布、生物转化及排泄等过程中药物效应及血药浓度随时间消长的规律，指导临床合理用药，为寻找新药或老药新用提供线索，为阐明生物机体的生物化学及生物物理现象提供科学依据。

护理药理学是以药理学理论为基础，以护理合理用药为切入点，阐明临床护理用药所必需的基本理论、基本知识和基本技能。其主要内容包括：药物的体内过程、药理作用、临床应用、不良反应、用药护理知识等。其任务是研究护理人员在全掌握药理学基本理论和基本知识的基础上，运用护理程序和方法合理用药、观察药效和药物不良反应，防止和减少药源性疾病和医疗事故的发生，以确保临床用药安全有效，提高护理质量和医疗水平。

## 二、药理学在临床护理用药中的地位

药物治疗、预防或保健是临床控制疾病最重要的手段，作为护理人员要有足够的药理学理论知识与熟练的相关技能，才能更好地与医生及其他保健人员合作，达到安全、有效、合理用药的目的。因此，药理学在临床药物治疗及用药咨询中发挥着重要的作用。

### （一）在药物治疗中的地位

护士在临床药物治疗过程中，既是药物治疗的实施者，也是用药前后的监护者。护理人员要有足够的药理学知识，才能明确医生的用药目的和正确实施药物治疗方案，积极主动地配合医生的治疗，提高执行医嘱的质量，避免盲目性和药疗事故的发生。熟悉所用药物的基本药理知识，在用药过程中能及时准确观察和正确评价药物疗效。熟悉药物可能产生的不良反应，才能有目的地进行用药监护，有效防止不良反应的发生。



## (二) 在用药咨询中的作用

护理人员也担负着用药教育、用药咨询的责任,应具有全面的药理学知识,如药物的主要成分、合理的用量及用法、正确的保存方法、起效时间、疗效特点及可能出现的不良反应等知识,才能担负起用药咨询的责任,正确地指导人群用药、药品保管、及时了解疗效产生的时间及不良反应的症状,才能真正为全社会的健康服务。

## 三、学习护理药理学的方法

护理药理学在医学知识和临床护理之间起着重要的桥梁作用,在学习方法上要注重以下几点。

(1) 充分利用基础医学知识和逻辑推理的方法,从人体形态、功能等多个角度加深对药理学知识的理解和掌握。

(2) 善于归纳、比较及分析本学科各章节的重点及难点,掌握药物的普遍性和特殊性,理解药物的双重性和量变与质变的规律性,提高学习效率和合理用药的能力。

(3) 重视理论与实际相结合,有效利用药物实验手段巩固、验证理论知识,锻炼实际操作能力及观察、分析、解决问题的能力。

(4) 联系护理专业实际,运用整体护理理念,将护理程序与护理用药知识紧密结合,提高自身的综合素质。

### 【知识拓展】



#### 毒物

在一定条件下,较小剂量就能够对机体产生损害作用或使机体出现异常反应的外源化学物称为毒物。毒物可以是固体、液体或气体,与机体接触或进入机体后,能与机体相互作用发生反应,引起机体功能或器质性的损害,严重的甚至会危及生命。毒物与非毒物没有绝对的界限,只是相对而言的。因此,确定所谓毒物或毒物衍生物必须考虑接触剂量、途径、时间及可能的影响因素。



### 课程思政

#### 药理学发展简史

神农尝百草、李时珍《本草纲目》、屠呦呦获得诺贝尔生理学或医学奖等我国医药辉煌成就,增强民族自豪感,鼓励学生努力学习,为医学贡献自己的力量。



## ■ 学习检测

### 单项选择题

1. 药物是（     ）。
  - A. 能干扰细胞代谢活动的化学物质
  - B. 具有滋补营养、保健康复作用的物质
  - C. 能用于疾病的诊断、预防与治疗或计划生育的特殊物质产品
  - D. 能影响机体生理功能的物质
  - E. 一种化学物质
2. 药理学研究（     ）。
  - A. 药物的化学结构
  - B. 药物作用的规律
  - C. 药物作用、体内过程及其临床应用的基本规律
  - D. 药物在体内的变化
  - E. 药物的不良反应
3. 药物效应动力学（药效学）研究（     ）。
  - A. 药物对机体的作用规律及其原理
  - B. 药物的治疗作用
  - C. 药物的作用机制
  - D. 影响药物疗效的因素
  - E. 药物在体内的变化

## 单元二

## 药物效应动力学

---

### 学习目标

1. 会判断药物的两重性以及药物不良反应的类型。
2. 能说出效价、效能、治疗指数、受体激动药，受体部分激动药、受体阻断药的概念。
3. 具备判断药物作用机制的能力。

### 预习案例

患者，女，48岁，因走路时感觉“胃痉挛”，在家自行口服阿托品治疗，用药后患者出现口干、畏光、心悸、体温升高等现象。

#### 思考

1. 该患者服药后出现此现象的原因是什么？
2. 如何区分药物的治疗作用和不良反应？



药效学是研究药物对机体的作用及其机制、量效关系规律的科学，是临床应用药物防治疾病和合理用药的主要依据。

## ■ 任务一 药物作用的基本规律

### 一、药物的基本作用

药物的基本作用是调节机体器官原有功能的水平。凡是使机体器官或组织原有生理、生化功能增强的作用称为兴奋作用，反之为抑制作用。同一药物作用于机体不同器官，也可引起性质完全相反的效应；同一药物因剂量的不同可使药物作用发生由量变到质变的变化。如过度兴奋可以转为衰竭，是一种特殊性质的抑制。

### 二、药物的作用方式

1. **局部作用与吸收作用** 局部作用是药物未吸收进入血液循环之前，在其用药局部所产生的作用；吸收作用是指药物从给药部位进入血液循环后，随体液分布到全身各部位所产生的作用。

2. **直接作用与间接作用** 直接作用是药物与器官或组织直接接触后所产生的作用；间接作用又称继发作用，是指药物的某一作用通过神经反射或体液调节而引起的其他作用。

### 三、药物作用的选择性

大多数药物吸收进入机体后，并不是对所接触的器官或组织发生同等强度的作用，而是对某些组织器官产生明显作用，对其他组织器官的作用不明显或无作用。作用范围窄则选择性高；相反，作用广泛则选择性低。药物的选择作用是相对的，可因剂量的变化而变化。选择作用与药物的分布、组织生化功能、细胞结构的差异性等因素有关，是药物分类的基础，也是临床选择用药的依据。

### 四、药物作用的临床效果

1. **治疗作用** 凡符合用药目的或能达到治疗效果的效应称治疗效果，也为药物的治疗作用。根据用药目的不同分为：消除原发致病因子，彻底治疗疾病的对因治疗（治本）；改善疾病症状，解除患者痛苦的对症治疗（治标）。一般情况下，对因治疗与对症治疗同等重要，应配合应用。在某些情况下，对症治疗比对因治疗更迫切，首先挽救生命，如高热引起的惊厥，剧痛引起的休克等。临床遵循中医学“急则治其标，缓则治其本，标本兼治”的原则。

2. **不良反应** 不符合用药目的，甚至给患者带来痛苦的反应统称为不良反应。主要表现为以下几个方面。

#### (1) 副作用

副作用指药物在治疗剂量时与治疗作用同时出现的、与治疗目的无关的痛苦或不适



的反应。其特点是：①一般危害不大的，为可恢复的功能性变化；②治疗作用与副作用可因用药目的不同而转变；③副作用是药物固有的，其原因是药物的选择性低；④可以预知，并可通过合理用药使之减轻。

### (2) 毒性反应

毒性反应是指由于剂量过大或长期应用药物或机体对药物敏感性过高而引起的机体功能失调、组织病理性变化。一般是可以预知的，且比较严重。

### (3) 后遗效应

后遗效应是指停药以后血浆药物浓度已降至阈浓度以下时残存的生物效应。后遗效应可能非常短暂，如服用巴比妥类催眠药后次晨的宿醉现象；也可能比较持久，如长期应用肾上腺皮质激素，由于对垂体前叶的负反馈作用引起肾上腺皮质萎缩，一旦停药后肾上腺皮质功能低下，数月内难以恢复；少数药物可以引起永久性器质性损害，如大剂量呋塞米、链霉素等可以引起永久性耳聋。

### (4) 停药反应

停药反应是指突然停药后原有疾病的加剧，又称回跃反应。

### (5) 变态反应和特异质反应

变态反应又称过敏反应，是与药物作用无关的病理性免疫反应。其特点是：①常发生于过敏体质的人；②致敏原是药物本身、药物体内的代谢产物或制剂中的杂质等；③变态反应与剂量无关；④反应性质因人而异，常有药热、皮疹、哮喘，甚至因过敏性休克而死亡。特异质反应是指患者对药物产生的遗传性异常反应。如葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏者，应用伯氨喹、奎宁、氯霉素、磺胺、维生素K后可发生溶血性反应。

### (6) 依赖性

依赖性是指长期应用具有依赖性的药物后，机体对这种药物产生了精神或生理性的依赖或需求。精神依赖性是指多次连续用药后，患者对药物产生精神（或心理）上的依赖，需要药物缓解精神紧张和情绪障碍。生理依赖性又称躯体依赖性 or 成瘾性，是指反复用药，若停药，可产生一种强烈的躯体症状，即戒断症状。



药害事件

## ■ 任务二 药物剂量与效应关系

药物剂量与效应的关系，简称量效关系。即在一定剂量范围内，随着药物剂量增加，药理效应也相应增强，二者成正比关系。当剂量超过一定限度时能引起中毒，甚至死亡。

### 一、药物的剂量

剂量即用药的分量。剂量的大小决定血药浓度的高低，与药物效应强度密切相关。



1. **最小有效量** 指出现疗效的最小剂量。
2. **治疗量** 指最小有效量与最大治疗量（极量）之间的剂量范围，既能对机体产生明显效应，又不引起明显毒性反应的剂量。
3. **极量（最大有效量）** 是国家药典明确规定允许使用的最大剂量，是医护人员用药剂量的最大限度。超过极量易引起中毒反应。临床用药除特殊需要外，一般不采用极量。
4. **最小中毒量** 超过极量，血药浓度继续升高，可引起毒性反应的最小剂量。
5. **致死量** 引起死亡的量，是临床绝对不允许使用的量。

## 二、量效曲线

药物的量效关系常用量效曲线来反映。以药物剂量或浓度为横坐标，药物效应强度为纵坐标，对应作图即可得量效曲线。

### （一）量反应型量效关系

药物的效应强度可用数字或量分级表示，如心率、血压、呼吸、尿量等，这种反应类型为量反应。药理效应可以用数或量分级表示，称为量反应，如心率、血压、排钠量等。量反应的量效曲线：纵坐标表示效应量，横坐标表示剂量。通常呈长尾 S 形曲线（直方双曲线）。如改用对数剂量，则使 S 形接近对称（图 2-1）。

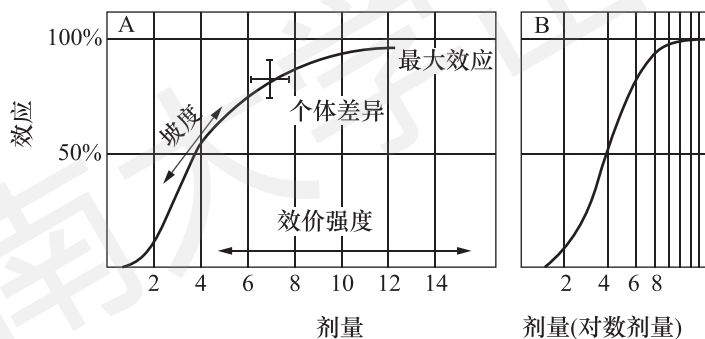


图 2-1 典型的药物量效曲线

1. **效价强度** 也称等效剂量，当药物达到一定效应时所需要的剂量，其值越小效价强度越大。
2. **效能** 也称为最大效应。即增加药物浓度或剂量，其效应不再继续增强时的药理效应极限。能引起相同药理效应的药物，其最大效应和效价强度并不一定相同。例如，在利尿药中，以排钠量为效应指标，氢氯噻嗪的效价强度较呋塞米强，环戊噻嗪又较氢氯噻嗪强 100 倍。但以最大效应比较，呋塞米较高，是高效利尿药，而氢氯噻嗪和环戊噻嗪相等为中效利尿药（图 2-2）。

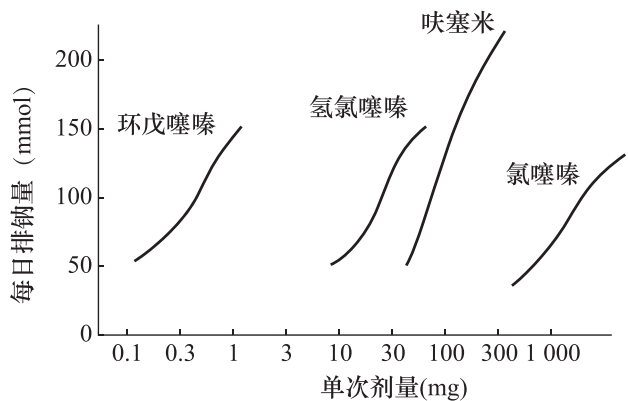


图 2-2 各种利尿药排钠量的比较

(二) 质反应型量效关系

药理效应只能用有或无、阳性或阴性表示，如动物毒性实验中的死亡与生存、惊厥与不惊厥等。其研究对象为一个群体，在研究过程中，常将实验动物按用药剂量分组，以阳性反应百分率为纵坐标，以剂量或浓度为横坐标作图，也可得到与量反应相似的曲线。如果按照药物浓度或剂量的区段出现阳性反应频率作图得到呈常态分布曲线。如果按照剂量增加的累计阳性反应百分率作图，则可得到典型的 S 形量效曲线（图 2-3）。

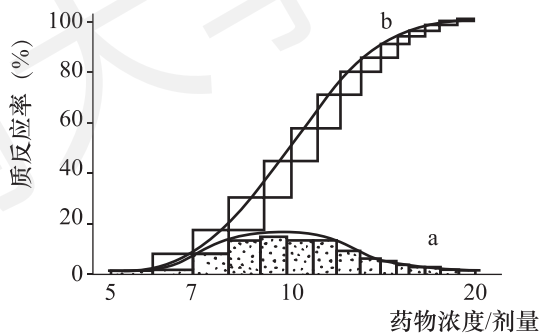


图 2-3 质反应型量效曲线

曲线a—区段反应率 曲线b—累计反应率

S 形曲线正中点的阳性率为 50%，故可求得 50% 阳性率时的剂量。根据所用指标不同，可分别得到半数有效量 ( $ED_{50}$ )，即能引起 50% 的实验动物出现阳性反应的药物剂量；如果效应为死亡，则称为半数致死量 ( $LD_{50}$ )。如果某药的  $ED_{50}$  值越小，而  $LD_{50}$  越大，说明该药越安全。通常将  $LD_{50}$  与  $ED_{50}$  的比值来表示药物的安全性，称为治疗指数 (TI)。



## ■ 任务三 药物与受体

药物大多通过干扰或参与机体的各种生理和生化过程而发挥作用，各类药物的作用机制是多种多样的，主要有：①改变机体内环境的理化性质；②参与或干扰细胞物质代谢过程；③影响生理物质转运；④对酶的抑制或促进作用；⑤作用于细胞膜的离子通道；⑥影响核酸代谢；⑦影响免疫机制；⑧作用于受体。本节简单介绍药物作用的受体机制。

### 一、受体的概念与特性

1. **受体** 是指与药物或生理活性物质结合并能传递信息，引起效应的细胞成分，它是存在于细胞膜上或胞质内的大分子蛋白质（糖蛋白或脂蛋白）。配体是能与受体结合的小分子物质。内源性配体一般是神经递质、激素或自体活性物质，能对相应的受体起激动作用，并引起特定的生理效应（兴奋或抑制）。

2. **受体特性** ①灵敏性：很低浓度的配体就可以与受体结合产生效应；②特异性：能作用于同一类型受体的配体化学结构非常相似；③可逆性：与配体的结合可以解离，而且配体不发生变化；④饱和性：受体的数目是有限的。

### 二、作用于受体的药物类型

1. **激动药** 与受体有较强的亲和力，也有较强的内在活性的药物。

2. **拮抗药** 与受体亲和力强，但缺乏内在活性，因占据受体而拮抗激动药作用的药物，也称为受体阻断药。

3. **部分激动药** 有亲和力，但内在活性不强的药物。单独应用时产生较弱的激动作用，而与较强的激动药合用时，拮抗激动药的部分作用。

### 三、受体的调节

受体的调节是指受体的数目、亲和力与内在活性受生理、病理或药物等因素的影响而发生变化的现象，是维持机体内环境稳定的重要因素。包括以下两种类型。

1. **受体脱敏** 是指长期使用一种激动药后，组织或细胞对激动药的敏感性和反应性下降的现象，是激动药耐受性产生的原因之一。

2. **受体增敏** 是由于受体激动药水平下降或长期应用拮抗药造成的受体敏感性和反应性增强的现象，是某些药物停药后出现停药反应或反跳现象的原因之一。如长期用 $\beta$ 受体阻断药，可使 $\beta$ 受体敏感性增加，若突然停药，体内去甲肾上腺素强烈地激动反应，可引起心动过速、心律失常等。



## 【知识拓展】

## 控释制剂

控制药物按恒速释放,以保持恒速吸收,一般是先制成含药片芯,然后在片芯外包裹一定厚度的半透膜,再采用激光技术在膜上打若干小孔。患者服用后,药片与体液接触,水从半透膜进入片芯,使药物溶解,当药片内部的渗透压高于外部时,药物便从小孔中徐徐流出而起效。

## ■ 学习检测

## 单项选择题

1. 药物产生副作用的药理学基础是( )。  
A. 用药剂量过大  
B. 药物作用选择性低  
C. 患者肝肾功能不良  
D. 血药浓度过高  
E. 用药时间过长
2. 下述剂量中可产生副作用的是( )。  
A. 治疗量  
B. 极量  
C. 中毒量  
D. 阈剂量  
E. 无效量
3. 链霉素引起的永久性耳聋属于( )。  
A. 毒性反应  
B. 过敏反应  
C. 不良反应  
D. 停药反应  
E. 治疗作用
4. 与药物过敏反应有关的是( )。  
A. 剂量大小  
B. 药物毒性  
C. 免疫功能  
D. 年龄、性别  
E. 用药途径

## 单元三

# 药物代谢动力学

---

### 学习目标

1. 能分析药物的体内过程及其影响因素。
2. 会比较恒比消除，恒量消除。
3. 会利用药物半衰期确定给药间隔时间。
4. 具有利用生理学知识，分析药物转运方式的能力。

### 预习案例

一患者为感染性疾病，在医生的指导下，患者服用阿莫西林胶囊。

#### 思考

简述阿莫西林胶囊在患者的体内过程。



药动学是研究机体对药物处置过程的科学，即研究药物在体内的吸收、分布、代谢及排泄过程和血药浓度随时间变化规律的科学。

任务一 药物的跨膜转运

药物在体内被吸收、分布、代谢和排泄都要通过各种脂质生物膜。药物通过生物膜的过程称药物的跨膜转运，大致可分为两种方式：主动转运和被动转运。大多数药物在体内的转运方式是被动转运。

一、被动转运

被动转运是药物依赖生物膜两侧的浓度差，从浓度高的一侧向浓度低的一侧扩散的过程，具有不消耗能量、不需要载体、无竞争抑制现象及无饱和现象等特点。大多数药物按被动转运方式通过生物膜。转运速度受药物分子大小、脂溶性、极性等因素影响。分子小、极性低、解离度小及脂溶性高的药物易通过生物膜，反之则不易（表 3-1）。

表 3-1 弱酸性和弱碱性药物在不同 pH 中被动转运的特点及意义

| 药物   | pH | 分子极性 | 脂溶性 | 解离度 | 被动转运 | 意义                                     |
|------|----|------|-----|-----|------|----------------------------------------|
| 弱酸性药 | 酸性 | ↓    | ↑   | ↓   | 易    | ①在胃内易吸收；<br>②主要分布于细胞外液；<br>③碱化尿液加速排泄。  |
|      | 碱性 | ↑    | ↓   | ↑   |      |                                        |
| 弱碱性药 | 酸性 | ↑    | ↓   | ↑   | 不易   | ①在肠液中易吸收；<br>②主要分布在细胞内液；<br>③酸化尿液促进排泄。 |
|      | 碱性 | ↓    | ↑   | ↓   |      |                                        |

二、主动转运

主动转运是药物从生物膜低浓度一侧向高浓度一侧转运。其特点是：①消耗能量；②需要载体；③有饱和现象及竞争性抑制现象。药物的主动转运主要在神经元、肾小管和肝细胞中进行。



药物的体内过程

任务二 药物的体内过程

一、药物的吸收

吸收是指药物从用药部位进入血液循环的过程。药物吸收速度主要影响药物作用的快慢，药物吸收的程度主要影响药物作用的强弱。影响药物吸收的因素有：



药物的吸收



1. **药物的理化性质、剂型、给药局部的酸碱度、血流状况及药物的相互作用** 这些因素主要影响被动转运。

2. **给药途径** 不同给药途径药物吸收快慢的顺序是：吸入给药 > 肌内注射 > 皮下注射 > 舌下给药 > 直肠给药 > 口服给药 > 皮肤。不同给药途径的吸收部位和影响因素不同（表 3-2）。

3. **首关消除** 首关消除是指某些口服药物经胃肠黏膜吸收，进入肝脏，通过肝脏代谢后，进入血液循环的有效药量明显减少的作用，又称首关效应。舌下给药可在很大程度上避免首关消除。

表 3-2 不同给药途径的吸收部位与影响因素

| 给药途径 | 吸收部位     | 影响因素                                              |
|------|----------|---------------------------------------------------|
| 口服   | 胃肠黏膜、小肠  | 服药时饮水量、胃肠道内容物的多少与性质、胃肠蠕动、胃肠道 pH 值、胃肠道血液循环及药物颗粒大小等 |
| 舌下   | 毛细血管     | 药物脂溶性大小、药物剂量                                      |
| 直肠   | 直肠下段毛细血管 | 直肠下段血液循环状况                                        |
| 吸入   | 肺泡上皮细胞   | 肺泡面积、肺血流量、药物的挥发性                                  |
| 肌内注射 | 肌肉组织毛细血管 | 药物的性质、局部血液循环状况                                    |
| 皮下注射 | 皮下组织毛细血管 | 药物性质及透脂酶                                          |

## 二、药物的分布

药物的分布是指药物吸收后，随血液循环到达机体各个部位和组织的过程。大多数药物在体内分布不均匀，这取决于药物与血浆蛋白结合率、器官的血流量、药物与组织的亲和力、体液 pH 及组织的特殊屏障等。一般而言，血流丰富的组织分布快，亲和力高的组织分布多。

1. **药物与血浆蛋白结合** 药物进入血液后不同程度地与血浆蛋白结合。结合的程度可以用结合反应平衡时药物与血浆蛋白结合的百分率表示，大小取决于药物与血浆蛋白之间的亲和力。因此，血液中的药物有两种存在形式，即结合型药物和游离型药物。

结合型药物的特点：①活性暂时消失；②结合是可逆的，并且处于动态平衡状态；③不易进行跨膜转运，暂时储存在血液中；④有饱和性，当血液中药物浓度过高结合达饱和时，游离药物浓度增多，药效增强，毒性增加；⑤结合特异性低，有竞争性。当时应用两种结合率高的药物时，可发生竞争性置换现象，导致游离药物浓度增加。



胎盘结构及血液循环模式图

2. **药物与组织细胞结合** 某些药物对某些组织有特殊亲和力，聚集于某些器官，与其组织细胞结合，使药物分布具有一定的选择性。如碘浓度在甲状腺中远高于血浆中。

3. **特殊屏障** 血脑屏障选择性地阻止多种物质由血液进入脑组



织，维持中枢神经系统内环境的相对稳定。脂溶性高、分子量小、极性低的药物易通过血脑屏障，从而对中枢神经系统产生作用。婴幼儿血脑屏障发育不完善，药物易通过血脑屏障，影响中枢神经的功能，甚至导致不良反应。胎盘屏障是指母体与胎儿血液之间的一种屏障，多数药物易通过胎盘屏障，母体用药可危及胎儿，甚至可引起畸胎或死胎。



血脑屏障图

**4. 体液 pH 值** 血浆和细胞外液 pH 为 7.4，细胞内液 pH 为 7.0，弱酸性药物在细胞外液解离多，不易进入细胞内；弱碱性药物则相反，容易进入细胞。临床上，弱酸性药物苯巴比妥中毒时，可口服碳酸氢钠使血及尿碱化，提升血液 pH，使弱酸性药物向细胞外液转移，脑细胞中药物减少，血浆中药量增多，并促使药物自尿液排泄，是重要的救治措施之一。

三、药物的代谢

药物的代谢又称生物转化，是指药物在生物体内经酶的作用发生化学变化的过程。大多数药物经代谢后，药理活性和毒性减弱或消失，即灭活。也有少数药物经代谢仍有药理活性，甚至有的从无活性药物转化成为活性药物，即活化。还有少数药物不经过转化，以原型从肾脏排泄。

人体内参与药物代谢的酶有血浆胆碱酯酶、神经末梢中的单胺氧化酶等，最重要的是存在于肝细胞微粒体内的混合功能酶系统，简称肝药酶。肝药酶是一组多功能酶系统，能转化数百种药物。肝药酶特点是：①专一性低；②活性有限，可发生竞争性抑制；③个体差异大；④易受某些药物所诱导或抑制。凡能使肝药酶活性增强或合成加速的药物，称药酶诱导剂；凡使肝药酶活性降低或合成减少的药物称药酶抑制药（表 3-3）。

表 3-3 药酶诱导剂和药酶抑制药的特点

| 类别    | 对药酶作用 | 对药物的影响 |      |      |      | 药物       |
|-------|-------|--------|------|------|------|----------|
|       |       | 代谢     | 血药浓度 | 药理活性 | 毒性反应 |          |
| 药酶诱导剂 | 活性增加  | 加快     | 下降   | 减弱   | 减弱   | 苯巴比妥、保泰松 |
|       | 合成加速  |        |      |      |      | 苯妥英钠、利福平 |
| 药酶抑制剂 | 活性减弱  | 减慢     | 上升   | 增强   | 增强   | 氯霉素、异烟肼  |
|       | 合成减少  |        |      |      |      | 对氨基水杨酸   |

四、药物的排泄

药物的排泄是药物或其代谢产物通过排泄器官或分泌器官排出体外的过程。机体排泄药物的主要器官是肾脏，其次是消化道、呼吸道、汗腺、乳腺等。

**1. 肾脏排泄** 肾脏是药物排泄最重要的器官。肾脏排泄药物可以通过肾小球滤过或肾小管分泌。分子量小的药物分子可通过肾小球滤过排泄，滤过后的药物分子可再吸收并受尿液 pH 和药物脂溶性的影响。其中，尿液的 pH 对药物排泄的影响较明显，如弱酸



性药在碱性尿液中解离度高，脂溶性低，重吸收少，排泄加快。临床上可根据需要改变尿液 pH 以促进或减慢药物排泄速度。如苯巴比妥钠中毒时，碱化尿液以加速排泄，缓解中毒症状。肾小管细胞可以主动转运方式排泄药物，其排泄具备主动转运特点。

**2. 胆汁排泄** 某些药物或其代谢产物可由胆管及胆总管进入肠腔，然后随粪便排泄。其中有些药物可经小肠上皮细胞吸收经肝脏进入血液循环，即肝肠循环。此时药物的消除缓慢，半衰期和作用时间明显延长。

**3. 其他排泄途径** 有些药物以简单扩散的方式随乳汁排出；有的药物经唾液腺和汗腺排泄；挥发性药物，如乙醇，可从肺排出等。

## ■ 任务三 药动学基本概念、参数及其意义

### 一、时量关系及时量曲线

时量关系是指进入体内的药量随时间的推移而发生变化的规律。为了揭示这一规律，对实验动物单次血管外给药，分时取血，测定血药浓度，以时间为横坐标、血药浓度为纵坐标所绘制的血药浓度随着时间变化而升降的曲线，即为时量曲线，亦称药时曲线（图 3-1）。药时曲线可分为 3 个时期：潜伏期、持续期及残留期。潜伏期是指用药后到开始出现作用的时间，静脉注射一般无此期。持续期指药物维持有效浓度时间。残留期是指药物浓度已降至最小有效浓度以下，但尚未自体内完全消除的时间。

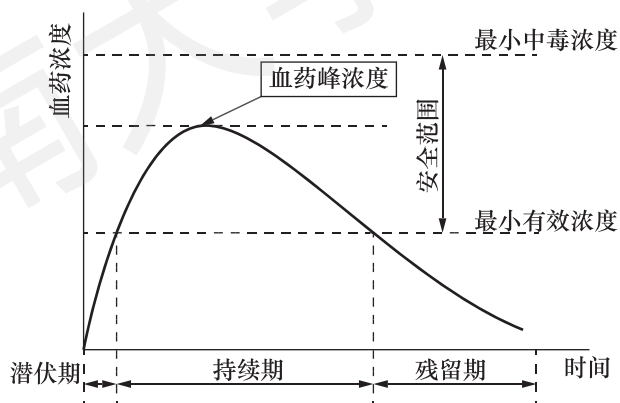


图 3-1 药时曲线

曲线中，升段反映吸收过程，此时消除过程已开始，只是吸收大于消除。其坡度反映吸收的速度。峰值，也称峰浓度，是给药后达到的最高血药浓度，此时吸收速度与消除速度相等。曲线的降段主要反映药物消除过程，此时仍有少量药物吸收，但消除大于吸收，其坡度反映消除的速度。从图中还可测量出最小有效浓度和最小中毒浓度，以此确定安全范围。

### 二、生物利用度

生物利用度指非血管途径给药，药物被机体吸收的速度和程度。它反映一个药物能



被机体吸收利用的多少，其计算方法为：

$$\text{生物利用度 (F)} = \frac{\text{进入血液循环的药量 (A)}}{\text{给药总量 (D)}} \times 100\%$$

影响药物生物利用度的因素除给药途径和机体个体差异外，药物颗粒的大小、剂型、填充剂的紧密度、赋形剂的差异、生产工艺的不同都会影响药物的生物利用度。所以，不同剂型的药物，同一剂型不同厂家的药物，同一厂家不同批号的药物，其生物利用度都可能不同，临床用药为保证用药的有效性及安全性，尽可能用同一厂家同一批号的药。

### 三、表观分布容积

表观分布容积 (Vd) 是指假定所给的药物均匀分布于机体所需要的理论容积，其计算公式为：

$$Vd (L) = \frac{(\text{体内药量 mg}) D}{(\text{血药浓度 mg/L}) C}$$

表观分布容积虽然是一个理论容量，但可以反映药物在体内分布的情况，如一个正常成人 Vd 在 5 L 左右时，此容积与血浆的容量相似，表示药物大部分分布于血浆；Vd 为 10~20 L 时，此容积与全身体液的容量相似，表示药物分布于全身体液中。若大于生理总容积，则说明药物分布到了组织器官中。药物分布容积越小，排泄越快；分布容积越大，排泄越慢。Vd 值特别大的药物，一般与肌肉或脂肪组织有较大的亲和力，排泄慢，易在体内蓄积。

### 四、药物消除动力学

#### (一) 一级动力学消除 (恒比消除)

一级动力学消除，亦称恒比消除，指体内药物在单位时间内按恒定的比例消除，表明消除的速度与血药浓度高低相关，即血浆药物浓度高，单位时间内消除的药量多；血浆药物浓度低，药物消除量也按比例减少。大多数药物在治疗量时都按一级动力学消除。

#### (二) 零级动力学消除 (恒量消除)

零级动力学消除，亦称恒量消除，指药物在单位时间内以恒定的数量消除，即不论血浆药物浓度高低，单位时间内消除的药量不变。一般药物达到一定高浓度或高剂量，其消除能力饱和时，才按恒量消除。当药物下降到机体最大消除能力以下时，再转为恒比消除。

### 五、半衰期

半衰期 (half-life time,  $t_{1/2}$ ) 通常指血浆半衰期，即血浆药物浓度下降一半所需要的时间，它反映了药物在体内消除的速度。

根据半衰期长短不同，可将药物分类，如短效 (1~4 h)、中效 (4~8 h)、长效 (8~24 h) 等，据此可确定药物的给药间隔时间。每一种恒比消除的药物，都有恒定的半衰期，如青霉素，从任何一个血浆浓度降低 50% 所需的时间均为 30 min。恒速静脉



滴注或分次恒量给药，经过 4~6 个半衰期，体内药物消除速度与给药速度基本相等，达到血药稳态浓度。停药后，药物的消除也需要经过 4~6 个半衰期（表 3-4）。

半衰期是一恒定值，不因血药浓度高低而变化，也不受给药途径的影响，但受肝肾功能的影响，肝、肾功能不全者，其半衰期延长，应及时调整给药剂量及给药间隔时间，以防止中毒。

## 六、稳态血药浓度

在临床治疗中，为了达到有效治疗效果，必须使药物达到并在一定时间内维持有效血药浓度至一定水平。恒比消除的药物都有一个恒定的半衰期，一般经过 4~6 个半衰期后，药物进入体内的药量与体内消除的药量达到平衡，血药浓度维持在一个相对稳定的水平，称为稳态浓度（ $C_{ss}$ ）（表 3-4）。稳态浓度的高低，取决于恒量给药的剂量，剂量大则稳态浓度高，剂量小则稳态浓度低。

表 3-4 恒比消除药物的消除与累积

| 半衰期 | 一次给药   |          | 连续恒速恒量给药 |       |
|-----|--------|----------|----------|-------|
|     | 消除总量/% | 体内剩余药量/% | 消除总量/%   | 累积量/% |
| 1   | 50     | 50       | 50       | 50    |
| 2   | 75     | 25       | 75       | 75    |
| 3   | 87.5   | 12.5     | 87.5     | 87.5  |
| 4   | 93.75  | 6.25     | 93.75    | 93.75 |
| 5   | 96.87  | 3.13     | 96.87    | 96.87 |
| 6   | 98.44  | 1.56     | 98.44    | 98.44 |
| 7   | 99.22  | 0.78     | 99.22    | 99.22 |

分次静脉注射或血管外恒量给药，随着药物的吸收、分布和消除过程，血药稳态浓度也有一定的波动，药时曲线呈锯齿形上升。给药间隔时间越长，稳态浓度上下波动越大，静脉注射时，血药浓度无波动，直接达到稳态水平（图 3-2）。

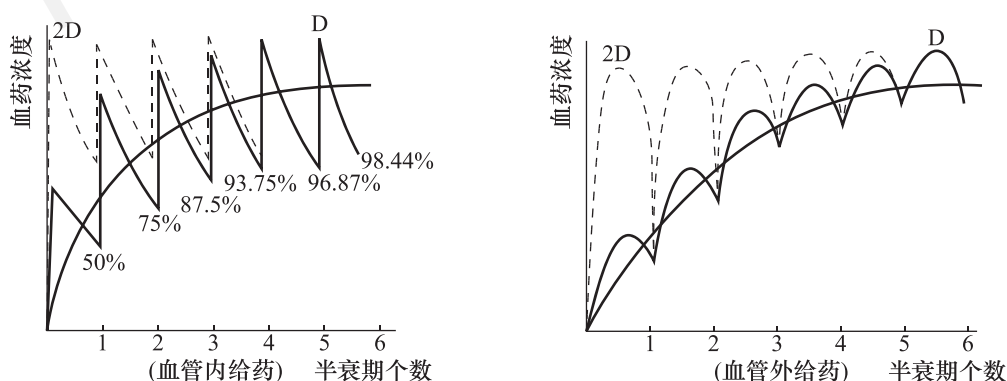


图 3-2 连续恒量给药的药时曲线

（虚线部分为首剂加倍时的药时曲线）



病情紧急时,为了使血药浓度迅速达到稳态浓度,用药时可首剂加倍(图 3-2)。即首次给药就能达到血药稳态浓度,如抗菌药治疗感染性疾病时,可采用此种用药方案。为了达到更好的治疗效果和减少不良反应,也可通过测定血药浓度对用药剂量进行调整。

【知识拓展】



#### 肝药酶诱导剂

苯妥英钠是肝药酶诱导剂,能加速华法林的代谢而降低药物的抗凝作用,需增加华法林的剂量,才能维持原来对凝血酶原时间的延长效果。如果患者停用苯妥英钠,肝药酶活性会恢复到诱导前的水平,需相应降低华法林的剂量,否则可引起大出血。

## 学习检测

### 单项选择题

1. 药物或其代谢物排泄的主要途径是( )。  
A. 肾                      B. 胆汁                      C. 乳汁  
D. 汗腺                      E. 呼吸道
2. 大多数药物的跨膜转运方式是( )。  
A. 主动转运                      B. 简单扩散                      C. 易化扩散  
D. 滤过                      E. 胞饮
3. 进行药物代谢的主要器官是( )。  
A. 肠黏膜                      B. 血液                      C. 肝脏  
D. 肾脏                      E. 肌肉
4. 影响药物血浆半衰期的主要因素是( )。  
A. 剂量大小                      B. 给药途径                      C. 给药次数  
D. 肝肾功能                      E. 给药速度

## 单元四

### 影响药物作用的因素

---

#### 学习目标

1. 能从机体和药物方面分析影响药物的作用。
2. 会以药效学，药动学方面判断药物的相互作用。

#### 预习案例

患者，男，60岁，患高血压伴动脉粥样硬化15年，因搬运家具劳累过度，突然出现心前区压榨性疼痛并向左肩放射，曾诊断为劳累性心绞痛，此时该患者立即将硝酸甘油口服，服药30 min后患者症状未得到缓解，急送医院救治。

#### 思考

该患者服用硝酸甘油后未得到缓解的原因是什么？



药物作用是药物与机体相互作用的综合表现。影响药物作用的因素很多，除前述的因素外，还有机体、药物及药物相互作用等方面的因素。护理用药时应掌握药理作用和影响药物作用的因素的相关知识，以护理程序为主线、协同医师最大限度地发挥药物的防治作用和减少药物不良反应。

## ■ 任务一 机体因素

### 一、年龄

不同年龄的人代谢功能和整体反应功能均有差异性，可影响药物的体内过程和效应。尤其应该注意小儿和老年人的用药护理。

**1. 小儿生理特点及用药护理** 小儿各种生理功能和调节系统发育不完善对药物的处理能力差且敏感性高，对经肝脏代谢的药、肾脏排泄的药、影响中枢神经系统的药、利尿药、激素类药特别敏感，因此在用药剂量上应严格按药典规定的小儿用药的计算方法给药。

**2. 老年人生理特点与用药护理** 老年人生理功能和调节系统逐渐减退，对某些药物处理能力和敏感性发生了变化，对心血管药、中枢神经系统药等易出现异常反应，甚至出现不良反应，因此用药剂量一般为青中年人的  $1/2 \sim 2/3$ 。



#### 课程思政

关注老年人、小孩用药，形成尊老爱幼的社会风尚。

### 二、性别

一般性别对药物作用的性质无明显影响。但在女性的月经、妊娠、分娩和哺乳的特殊生理时期，如用药不当，可能会引起不良反应或者造成严重后果（表 4-1）。

表 4-1 女性特殊生理时期的用药护理

| 特殊生理时期 | 不宜应用的药物     | 可能造成的后果          |
|--------|-------------|------------------|
| 月经期    | 泻药          | 盆腔充血、肠蠕动增强，月经过多  |
|        | 抗凝血药        | 影响血液凝固，经期延长      |
| 妊娠期    | 锂盐、苯妥英钠、地西泮 | 可通过胎盘屏障，致畸作用     |
|        | 泻药          | 子宫兴奋，导致流产或早产     |
|        | 四环素         | 影响胎儿骨骼和牙的发育      |
| 分娩期    | 吗啡          | 通过胎盘屏障，抑制胎儿呼吸    |
|        | 麦角新碱        | 子宫强直性收缩，可致胎儿宫内窒息 |
|        | 地西泮         | 抑制子宫平滑肌收缩，影响产程   |
| 哺乳期    | 吗啡          | 通过乳汁分泌，引起婴儿呼吸抑制  |
|        | 利舍平         | 可致婴儿心率减慢         |



### 三、营养状态

营养不良者体重轻、脂肪少、血浆蛋白含量少，影响药物分布和药物血浆蛋白结合率；肝药酶含量少或活性较低，影响药物代谢；机体应激功能、免疫功能、调节功能降低，影响药物效应，增加不良反应。

### 四、精神因素

人的心理和精神状态，对药物效应可产生明显影响。乐观的情绪有利于药物作用的发挥，而恐惧或消极情绪不利于疾病的治疗。家属及医护人员的语言和态度也会影响患者的情绪。因此，医护人员应该以人为中心，从生物、心理、社会多方面热情服务，鼓励其建立战胜疾病的信心，以增加疗效。根据患者精神因素的特点，必要时可采取安慰剂疗法，消除其对药物效应的心理影响。安慰剂是指某些无药理活性、外观与有药理活性的药物完全一样的制剂，其对一些与精神活动有关的慢性疾病或一般的主观症状（如神经症）可取得相当的疗效。

### 五、昼夜节律

有些药物的体内过程和药物作用有明显的昼夜节律性，如人的肾上腺皮质激素分泌高峰在清晨（8~10 h），中午分泌下降，午夜分泌量达到最低值。因此，临床上对于某些须长期用肾上腺皮质激素治疗的慢性疾病，采取清晨一次顿服肾上腺皮质激素的方法，既有明显的治疗作用，也减少了不良反应。

### 六、病理状态

病理状态时，人体的生理生化功能发生了变化，从而对药物的反应也会发生变化。如小剂量升压药会给高血压患者带来严重后果；解热镇痛药只对发热患者有效；有机磷酸酯类药物中毒时能耐受较大剂量的阿托品；肝肾功能不全会影响药物的转化和排泄，使药物的半衰期延长，易造成蓄积中毒。相反，如需要在肝脏活化的可的松等药，则会因肝功能下降疗效减弱。另外，有的药物可增加或诱导自身潜在的疾病，如水杨酸类可诱发潜在性溃疡；氢氯噻嗪可加重糖尿病等。故用药过程中，要全面了解患者病理情况及药物的特点，避免病理因素影响药物疗效。

### 七、遗传因素

遗传基因组成的差别构成了人体对药物反应的差异性。表现在：①遗传因素对药动学的影响，如快乙酰化者，口服1次异烟肼后， $t_{1/2}$ 为45~100 min，慢乙酰化者 $t_{1/2}$ 为2~4 h；②遗传因素对药效学的影响，如高铁血红蛋白还原酶缺乏者，使用硝酸酯类可致组织缺氧、发绀等。



## ■ 任务二 药物因素

### 一、药物的化学结构与理化性质

化学结构相似的药物其药理作用相似，如氨基苷类抗生素具有相似的化学结构，也有相似的抗菌作用；但有些化学结构相似的药物，却出现相互拮抗的作用，如磺胺类药与对氨基苯甲酸化学结构相似，可竞争性抑制二氢叶酸合成酶，使细菌二氢叶酸合成受阻，产生抗菌作用。药物化学结构的变化也可使其理化性质改变，影响药物吸收、分布、排泄，进而对药物作用快慢、强弱、维持时间的长短产生明显的影响。

### 二、药物的剂量

药物的剂量可以决定药物和机体相互作用的程度，在一定范围内，剂量越大，药物浓度越高，药物作用越强；剂量越小，则药物作用越弱。

### 三、药物制剂

药物制剂有多种形式，不同制剂其生物利用度不同，可影响药物的吸收与血药浓度，从而影响药物作用。

### 四、给药的因素

#### (一) 给药途径

不同的给药途径对药物的吸收、分布、排泄均有很大影响，往往能改变药物作用的性质和强度（表 4-2）。

表 4-2 常用给药途径的特点及护理用药要点

| 给药途径  | 适宜的剂型     | 特点                                         | 护理用药要点                                          |
|-------|-----------|--------------------------------------------|-------------------------------------------------|
| 消化道给药 |           |                                            |                                                 |
| 口服    | 片剂、溶液、胶囊剂 | ①最常用，简便、安全、经济<br>②吸收慢，易受消化液影响<br>③对胃肠道有刺激性 | ①根据药物性质餐前（后）服用<br>②有配伍禁忌的药避免同服<br>③呕吐、昏迷、急危患者不用 |
| 舌下    | 脂溶性大的片剂   | ①无首关消除<br>②吸收快，作用迅速                        | ①硝酸甘油、硝苯地平、异丙肾上腺素<br>②小剂量使用                     |



续表 4-2

| 给药途径  | 适宜的剂型             | 特点                                                 | 护理用药要点                                                  |
|-------|-------------------|----------------------------------------------------|---------------------------------------------------------|
| 直肠    | 栓剂、溶液             | ①无首关消除<br>②给药不方便<br>③吸收快、刺激性小                      | ①用前排空大便<br>②栓剂应推至直肠括约肌以上<br>③灌肠药温应与体温接近                 |
| 呼吸道给药 |                   |                                                    |                                                         |
| 呼吸道   | 气雾剂、挥发性药          | ①吸收快、显效快<br>②可产生局部和全身作用<br>③需要特殊设备<br>④对气雾剂颗粒大小有要求 | ①有配伍禁忌的药一次只给一种<br>②蒸气吸入时防烫伤<br>③氧气吸入时调节适宜后置入患者口腔        |
| 注射给药  |                   |                                                    |                                                         |
| 皮下注射  | 水溶性注射剂            | ①吸收均匀、缓慢<br>②疼痛<br>③消毒不严格，易感染                      | ①严格无菌操作<br>②刺激性大，油剂不宜使用<br>③三角肌下缘 30°~40°进针             |
| 肌肉注射  | 注射剂、水溶液<br>混悬剂、油剂 | ①吸收快、作用快<br>②刺激性大、收缩血管<br>③消毒不严格，易感染               | ①严格无菌操作<br>②避免损伤神经、血管引起缺血、坏死<br>③不误入血管<br>④缓慢推注，观察用药后反应 |
| 静脉注射  | 注射剂、水溶液           | ①无吸收过程，作用快<br>②剂量、速度易控制<br>③刺激性大的药稀释后使用            | ①严格无菌操作，排出空气<br>②注意药物渗透压、透明度、无热源<br>③防止药液外漏，混悬剂、油剂禁用    |

## (二) 用药次数与给药时间

1. 用药次数与给药的间隔时间 应该参考药物的半衰期 ( $t_{1/2}$ )，重复给药时原则上每隔一个  $t_{1/2}$  给药一次。间隔时间缩短，易导致药物蓄积；间隔时间过长，会加大血药浓度的波动，从而影响疗效；肝肾功能不良时，可以适当延长给药间隔时间。

2. 给药时间 根据药物及其适应证的特点选择适宜的给药时间，如催眠药应睡前服用；健胃药宜餐前服用；助消化药宜餐时服用；驱虫药宜空腹或半空腹时用；对胃肠有



刺激性的药物宜餐后服用等。亦可参考人体生理活动的生物节律变化择时给药,既可充分调动人体抗病能力,又可较好地发挥药物疗效,减少不良反应。

### (三) 药物的相互作用

同时或间隔一定时间给予至少两种药物称为联合用药,其目的是增强疗效,减少药物的不良反应。但在联合用药时,在体外或体内,以直接或间接的方式改变另一种药物的药理作用,称为药物的相互作用。

**1. 药物在体内的相互作用** 药物在体内可发生药动学和药效学的相互作用。前者是指同时或连续使用至少两种药物时,药物在吸收、作用、代谢、排泄过程中被其他药物干扰,改变药物在作用部位的浓度,使药物效应增强或减弱。如四环素会影响铁剂在肠道吸收,从而减弱其药效;丙磺舒抑制青霉素在肾小管分泌,从而延长其作用时间。后者是指同时或连续使用至少两种药物时,机体器官或细胞对药物的反应被其他药物改变,导致药物效应增强或减弱。如阿托品阻断 M 受体对抗毛果芸香碱激动 M 受体的作用。

**2. 药物在体外的相互作用** 药物在体外的相互作用又称配伍禁忌,即至少两种药物调配在一起时,药物与药物、药物与溶媒之间发生理化反应(如混浊、沉淀、变色、减效、失效或产生有害物质)而使药效降低或毒性增强的现象。如青霉素 G 能与氯丙嗪、地塞米松、维生素 C 等药物发生相互作用,为静脉滴注配伍禁忌。

总之,应积极采用合理的联合用药,避免不合理的联合用药。只有根据疾病和机体的具体情况,选择最佳的药物及药物制剂,制定和调整适当的给药方案,配合生理、心理和社会等方面的综合保护措施,才能达到有效安全用药。



处方药与非处方药的区别

#### 【知识拓展】

##### 缓释制剂

缓释制剂是先将药物制成小的颗粒,分作数份,少数不包衣为速释部分,其他分别包上厚薄不同的衣为缓释部分。取上述颗粒以一定比例混合,这样各种药物颗粒便像接力跑一样持续发挥作用,达到预期的效果。服用缓释片剂时须用水吞服,严禁嚼碎或击碎分次使用。如阿司匹林缓释制剂、酚麻美敏(泰诺)缓释制剂。

#### 课程思政

泡腾片剂导致孩子死亡案例,要学生注意泡腾片剂使用方法及注意事项,提高学生在给药过程中的责任心。



## ■ 学习检测

### 单项选择题

1. 长期应用某药后需要增加剂量才能奏效，这种现象称为( )。  
A. 耐药性                      B. 耐受性                      C. 成瘾性  
D. 习惯性                      E. 适应性
2. 以下各项中不是机体对药物影响的是( )。  
A. 年龄                      B. 性别                      C. 遗传  
D. 生理状态                      E. 剂量