

巅峰计划 高端教辅笔记-药理学

一、总论

1. 药效学

	特点	代表药物
副反应	1 治疗剂量下发生的，与用药目的无关 2 因药物选择性低而引起 3 药物本身固的，可预知但不一定能避	阿托品
毒性反应	剂量过大或慢性蓄积引起	洋地黄
后遗效应	停药后血药浓度降至阈浓度以下引起的药理效应	地西洋
停药反应（助理不考）	长期服药后，突然停药原有疾病加重	普萘洛尔
变态反应	与药物原有效应无关，拮抗剂解救无效	青霉素
特异质反应（助理不考）	对药物很敏感，严重程度与剂量成正比	利多卡因

药物与受体

（一）药物作用于受体必须具备的条件：① **亲和力**：药物与受体结合的能力；② **内在活性**：药物激活受体产生效应的能力。

（二）分类根据内在活性，对作用于受体的药物可分类为

	完全激动药	部分激动药	拮抗剂
亲和力	有	有	有
内在活性	有（强）	不强	无/较弱

第二节 药物代谢动力学

- （1）首关清除最常见的给药途径是口服给药。
- （2）首关清除最主要的器官是肝脏，肺和肠壁细胞也可成为首关清除的器官。
- （3）舌下给药和直肠给药可避免肝脏的首关清除。

血脑屏障和胎盘屏障		
	血脑屏障	胎盘屏障（助理不考）
屏障部位	血浆与脑脊液间的屏障	胎盘绒毛与子宫血窦之间的屏障
屏障作用	允许 脂溶性高、分子量小、结合型 的药物通过	几乎所有的药物都能穿透胎盘进入胎儿体内（ 形同虚设 ） 胎盘对药物的转运 无屏障作用
生理意义	脑膜炎患者，血脑屏障对青霉素通透性增大，使青霉素在脑脊液中可达到有效治疗浓度	胎儿血液的药物浓度通常与母亲的血浆 浓度相似 ，故孕妇禁用有致畸作用或对胎儿有毒性的药物

三、药物消除动力学（助理不考）

一级消除动力学与零级消除动力学的比较

	一级消除动力学（恒比消除）	零级消除动力学（恒量消除）
别称	线性动力学	非线性动力学
特点	1 以 恒定的百分比消除 ，但单位时间内实际消除的药量随时间递减 ② 药物消除 $t_{1/2}$ 恒定不变 ，与剂量或药物	1 以 恒定的速率消除 ，单位时间内消除的药物量不变 2 半衰期与浓度成正比

	浓度无关 ③5个 $t_{1/2}$ 可达稳态血药浓度 ④5个 $t_{1/2}$ 在体内全部清除干净 ⑤是体内大多数药物的消除方式	③ $t_{1/2}$ 不固定
药-时曲线	常规坐标轴上呈曲线 半对数坐标图上为直线，呈衰减指数	常规坐标轴上呈直线 半对数坐标图上，下降部分呈曲线

第三节胆碱受体激动药

器官	效应
心脏	心率 ↑、心肌收缩力 ↑、传导速度 ↑
血管	动、静脉平滑肌舒张
气管	支气管平滑肌收缩、支气管腺体分泌增加
胃肠道	胃肠平滑肌收缩，运动增加，胃肠括约肌舒张，胃肠腺分泌增强
眼	虹膜括约肌收缩 f 瞳孔收缩，睫状肌收缩
腺体	分泌增加（汗腺、唾液腺、泪腺、鼻咽腺体分泌增加）
感受器	兴奋颈动脉体和主动脉体化学感受器

二、毛果芸香碱

1. 药理作用 可直接作用于副交感神经（包括支配汗腺的交感神经）节后纤维支配的效应器官的 M 胆碱受体，尤其对眼和腺体作用较明显。毛果芸香碱与阿托品作用相反。

	毛果芸香碱
瞳孔	缩瞳（激动瞳孔括约肌，使瞳孔缩小）
眼内压	降低眼内压（瞳孔缩小、虹膜向中心拉动，前房间隙扩大，房水于流入巩膜静脉窦）
眼调节	调节痉挛（睫状肌紧张，悬韧带松弛，晶状体变凸，只适于视近物，造成视远物模糊不清）
腺体	分泌增加（汗腺、唾液腺、泪腺、胃肠腺、胰腺、呼吸道黏膜）

第四节抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药

	症状	解救药品
M 样作用	眼 ：瞳孔缩小，中毒早期可能并不出现。此外，尚可见视物模糊或睫状肌痉挛所致的眼痛	阿托品
	腺体 ：出现流涎和出汗，严重者可可见口吐白沫，大汗淋漓	
	呼吸系统 ：支气管平滑肌收缩和腺体分泌物增加，引起呼吸困难甚至肺水肿	
	胃肠道 ：胃肠道平滑肌兴奋及有机磷酸酯类对胃肠道黏膜的刺激作用，出现恶心、呕吐、腹痛和腹泻等症状	
	泌尿系统 ：严重患者可由于膀胱逼尿肌痉挛性收缩而引起小便失禁	
N 样作用	骨骼肌 ：N 受体激动表现为肌束抽搐，严重时可因呼吸肌麻痹而死亡	解磷定
中枢症状	表现为先兴奋、不安、继而出现惊厥，后转为抑制，出现意识模糊、共济失调、反射消失、昏迷等症状	解磷定

第五节 M 胆碱受体阻断剂

一、阿托品

（一）药理作用 阿托品竞争性拮抗 M 胆碱受体。阿托品的作用广泛、各器官对其敏感性不同。随着剂量增加可依次出现腺体分泌减少、瞳孔扩大和调节麻痹，心率加快，胃肠道及膀胱平滑肌抑制，大剂量可出现中枢症状。

眼	扩瞳 ：松弛瞳孔括约肌，使瞳孔扩大肌功能占优势 升高眼压 ：瞳孔扩大，虹膜退向边缘，前房间隙变窄，阻碍房水回流如巩膜静脉窦 调节麻痹 ：睫状肌松弛，悬韧带紧张，晶状体变扁，遮光度减低，只适合看原物
腺体	分泌减少 ：阻断 M 胆碱受体，抑制唾液腺、汗腺、泪腺、呼吸道腺体分泌
胃酸	抑制胃酸分泌
胃肠道	抑制胃肠道平滑肌痉挛 ，降低肠蠕动和频率，缓解胃肠绞痛
泌尿系	舒张尿道、输尿管平滑肌
心血管	心率加快 ，治疗量对血管和血压无明显影响
CNS	治疗剂量可 轻度 兴奋延髓及高级中枢，较大剂量可轻度兴奋延髓和大脑

第六节 肾上腺素受体激动药

肾上腺素

1. 药理作用 肾上腺素主要激动 α 和 β 受体。

部位	药理机制	药理作用
心脏	激动心脏 β ₁ 受体	正性作用（ 心缩力加强、心率加快、传导加速 ）
血管	激动 α ₁ 受体	舒张外周皮肤、黏膜血管
	激动 α ₂ 受体	舒张冠脉、骨骼肌、肝脏血管
血压	效应与药物剂量关系	治疗量使收缩压升高、舒张压不变或下降，脉压增大；大剂量使收缩压和舒张压均增高
支气管	激动平滑肌 β ₂ 受体	舒张支气管
	激动黏膜及肥大细胞 β ₂ 受体	抑制肥大细胞释放组胺和其他过敏物质
	激动黏膜血管 α 受体	使其收缩，消除支气管黏膜水肿
胃肠道	激动胃肠平滑肌 β ₁ 受体	抑制 胃肠 运动，使收缩频率和幅度均减小
糖代谢	激动 α 和 β ₂ 受体	使肝糖原分解，升高血糖
脂代谢	激动 β ₃ 受体	加速脂肪分解，使游离脂肪酸增高
CNS	肾上腺素不易通过血脑屏障	治疗剂量无中枢兴奋作用，大剂量出现中枢兴奋症状

肾上腺素能药物的异同

	去甲肾上腺素	肾上腺素	异丙肾上腺素	多巴胺
受体作用	α ₁ 、β ₁	β ₁ 、β ₂	β ₁ 、β ₂	β ₁ 、DA
心脏	+	+++	+++	+
血管	收缩	与受体分布有关	扩张	与受体分布有关
收缩压	升高	升高	升高	升高
舒张压	升高	不变/降低	下降/不变	—

第七节 肾上腺素受体阻断药

(二) β 肾上腺素受体阻断药

	药理机制	药理作用
心脏	阻断心脏 β ₁ 受体	心缩力↓、心率↓、心输出量和耗氧量↓
血管	阻断心脏 β ₂ 受体	收缩骨骼肌、肝、肾血管，血量减少
支气管	阻断支气管平滑肌 β ₂ 受体	收缩支气管平滑肌，诱发哮喘发作
肾素	阻断肾小球旁器 β ₁ 受体	抑制肾素释放，降低血压
糖代谢	对正常人血糖无影响	延缓使用胰岛素后血糖水平的恢复
脂代谢	阻断 β ₃ 受体	抑制交感神经兴奋所引起的脂肪分解
甲状腺	可以抑制甲状腺素 (T ₄) - 为三碘甲状腺原氨酸 (T ₃)	降低甲状腺激素水平

第八节局部麻醉药

常用局麻药及不良反应

	普鲁卡因	利多卡因	丁卡因
类别	酯类局麻药	酰胺类局麻药	酯类局麻药
特点	脂溶性低、黏膜穿透力弱	起效快、作用持久、穿透力强	毒性大，穿透力强
临床应用	浸润麻醉、传导麻醉、蛛网膜下腔麻醉和硬膜外麻醉	全能麻醉药，主要用于传导麻醉、硬膜外麻醉	表面、传导麻醉 腰麻、硬膜外麻醉
不良反应	过敏故用药前应做皮肤过敏试验	—	毒性大，一般不用与浸润麻醉

第九节抗癫痫药和抗惊厥药

一、抗癫痫药

(一) 苯妥英钠

1. 药理作用

(1) 苯妥英钠不能抑制癫痫病灶异常放电，但可阻止其向正常脑组织扩散。

(2) 膜稳定作用降低细胞膜对 Na^+ 和 Ca^{2+} 的通透性，抑制 Na^+ 和 Ca^{2+} 的内流，从而降低了细胞膜的兴奋性，使动作电位不易产生。

(二) 卡马西平

1. 药理作用 与苯妥英钠相似，治疗浓度时能阻滞 Na^+ 通道，抑制癫痫病灶及其周围神经元放电。同时还能增强中枢性抑制递质 GABA 在突触后的作用。

二、抗惊厥药——硫酸镁（助理不考）

1. 药理作用 给药途径不同，硫酸镁可产生完全不同的药理作用。中枢抑制口服硫酸镁有泻下及利胆作用，但很少吸收。硫酸镁注射给药，可引起血管扩张，导致血压下降；作用和骨骼肌松弛作用。

2. 临床应用 临床上主要用于缓解子痫、破伤风等惊厥，也常用于高血压危象。

3. 不良反应与防治 血镁 $> 3.5\text{mmol/L}$ ，即可出现中毒症状，引起呼吸抑制、血压剧降和心脏骤停而致死。肌腱反射消失是呼吸抑制的先兆，连续注射过程中应经常检查腱反射。中毒时应立即进行人工呼吸，并缓慢静脉注射氯化钙或葡萄糖酸钙予以紧急抢救。

第九节镇静催眠药

1. 苯二氮卓类：代表药物：地西洋（安定）

2. 安定的作用：抗焦虑，镇静、催眠，中枢肌肉松弛，抗癫痫（癫痫持续状态首选药）、对快动眼睡眠时相影响小。无论多大量绝无麻醉作用，中毒解救用氟马西尼。

3. 苯巴比妥（同安定）特有作用：诱导肝脏内的葡萄糖醛酸转移合成并增强活性减轻黄疸能治疗新生儿高胆红素血症

第十节抗癫痫药和抗惊厥药

① 苯妥英钠——大发作局限性发作首选 ② 卡马西平——三叉神经病首选无论是单纯部分性癫痫还是复杂部分性癫痫的首选

③ 乙琥胺——全面发作中的小发作、失神发作首选

④ 丙戊酸钠——全面发作中的大发作，次选苯妥英钠

⑤ 安定——癫痫持续状态

第十一节抗帕金森药（助理不考）

1. 补充左旋多巴 5 宁美（卡比多巴+左旋多巴）：可减少外周多巴胺生成，增加脑内多巴胺浓度，

左旋多巴副作用——起效慢 2~3 周才起效，肌肉震颤疗效极差。

2. 多巴胺受体激动剂——溴隐亭。

3. 单胺氧化酶抑制剂——苯丙胺（司米吉兰）。

4. 中枢抗乙酰胆碱药——安坦（盐酸苯海索）：中枢性抗乙酰胆碱药对肌肉震颤效果好，是氯丙嗪引起锥体外系反应的首选药。

治疗：<55 岁用单胺氧化酶抑制剂+多巴胺受体激动剂，>55 岁替代治疗用左旋多巴——心宁美

第十二节 抗精神失常药

抗精神失常药

（一）氯丙嗪（冬眠灵）

1. 药理作用及临床应用

	药理机制	药理作用
抗精神病作用	阻断中脑-边缘系统和 中脑-皮层系统的多巴胺受体	1 对中枢系统具有较强的抑制作用 2 良好的抗精神分裂症的作用 ③对抑郁无效，甚至可能加剧
镇吐作用	1 小剂量：可抑制催吐化学感受区； ②大剂量：直接抑制呕吐中枢	1 有较强的镇吐作用，用于顽固性呃逆 ②对运动症引起的呕吐无效
体温调节	抑制下丘脑体温调节中枢	不仅降低发热机体的体温，也能降低正常体温
自主神经系统	阻断肾上腺 α 受体及 M 胆碱受体	血管扩张、血压下降、口干、便秘、视力模糊
内分泌系统	阻断结节-漏斗系统中的 D2 受体，促进下丘脑分泌催乳素释放因子、卵泡雌激素释放因子等	1 促进催乳素分泌 2 抑制促性腺激素、糖皮质激素、生长激素分泌

（二）丙米嗪

1. 药理作用 主要阻断 NA、5-HT 在神经末梢（前膜）的再摄取，从而使突触间隙的递质浓度增高，而发挥抗抑郁作用。其药理作用为：X

（1）中枢神经系统：正常人口服本药后，出现困倦、头晕、口干、视力模糊及血压稍降等抗胆碱反应。抑郁症患者连续服药后，情绪提高，精神振奋，出现明显抗抑郁作用。连续用药 2~3 周后才见效。

（2）自主神经系统：治疗量丙米嗪能阻断 M 胆碱受体，引起阿托品样作用（视物模糊、口干、便秘、尿潴留等）。

（3）心血管系统：治疗量丙米嗪能降低血压，心律失常，心动过速。对心肌有奎尼丁样直接抑制效应。

（三）碳酸锂（助理不考）

1. 药理作用 本品主要以锂离子形式发挥作用。治疗量锂盐对正常人精神活动几无影响，但对躁狂症发作者则有显著疗效，使言语、行为恢复正常。

四、氯氮平（助理不考）

1. 药理作用 苯二氮卓类抗精神病药，为新型抗精神病分裂症要。氯氮平是选择性 D4 亚型受体拮抗药，几乎无锥体外系反应。

（五）氟西汀（百忧解）

1. 药理作用是一种强效选择性再摄取抑制剂，比抑制 NA 摄取作用强 200 倍

第十三节 镇痛药

(一) 吗啡

1. 中枢神经系统

	药理机制	药理作用
镇痛	激动中枢的阿片受体	强大的镇痛作用 ，对神经性疼痛效果较差
镇静 欣快	激活边缘系统、蓝斑核的阿片受体	能改善疼痛引起的焦虑、紧张、恐惧等；引起欣快感、表现为满足感、飘然欲仙感
抑制 呼吸	降低脑干呼吸中枢对血液 CO ₂ 张力的敏感性，抑制呼吸调节中枢	呼吸频率减慢、潮气量降低、每分通气量减少；呼吸抑制是吗啡中毒的 主要死因
镇咳	直接抑制延髓咳嗽中枢	咳嗽反射减轻或消失
缩瞳	瞳孔缩小呈针尖样 （吗啡的中毒表现）	兴奋副交感神经，瞳孔括约肌收缩

2. 平滑肌

	药理机制	药理作用
胃肠道平滑肌	减慢为蠕动，延缓胃排空和肠内容物通过、抑制腺体分泌	引起食物反流、便秘
胆道	引起胆道奥迪氏括约肌的挛缩	上腹部不适，甚至胆绞痛； 胆绞痛患者禁用
支气管	促进柱状细胞释放组胺	收缩支气管， 支气管哮喘患者禁用
子宫	降低子宫张力、收缩频率和幅度	可延长产程，故孕妇禁用
膀胱	提高膀胱括约肌张力和膀胱容积	尿潴留

(二) 哌替啶

1. 药理作用 激动 μ 型阿片受体，药理作用与吗啡基本相同。本品能提高平滑肌和括约肌的张力，但因作用时间短，较少引起便秘和尿潴留。大剂量哌替啶也可引起支气管平滑肌收缩，无明显中枢性镇咳作用；有轻微的子宫兴奋作用，但对妊娠末期子宫收缩无影响，也不对抗缩宫素的作用，故不延缓产程。

(三) 纳洛酮

1. 药理作用 竞争性拮抗阿片受体，强度依次为 $\mu > \kappa > \delta$ 受体。

第十四节 解热镇痛抗炎药 阿司匹林（乙酰水杨酸）

1. 药理作用

药理作用	药理机制
抗炎	抑制环氧化酶（COX 酶-1），从而抑制前列腺素的合成
镇痛	抑制前列腺素合成，降低缓激肽等致痛物质的敏感性 部分能产生中枢性镇痛作用
解热	抑制下丘脑前列腺素的生成，促使升高的体温恢复到正常水平，对正常体温 没影响
抗凝作用	抑制环氧化酶-1，减少血栓素 A ₂ （TXA ₂ ）合成，从而影响血小板的聚集及抗血栓作用

2. 临床应用

	临床应用
解热镇痛	具有较强的解热、镇痛作用，用于头痛、牙痛、肌肉痛、痛经及感冒发热等
抗风湿	迅速缓解 风湿性关节炎 的症状

抗凝	治疗各种原因导致的 血栓 形成
川崎病	阿司匹林+丙种球蛋白联合治疗 小儿川崎病

	不良反应及禁忌症
胃肠道反应 (最常见)	①口服：直接刺激胃粘膜，引起上腹不适、恶心、呕吐 ②抗风湿治疗可引起胃溃疡及无痛性出血，抗酸药可减轻胃肠道反应
加重出血倾向	①大剂量阿司匹林可加重出血倾向，维生素 K 可以预防 ②严重肝病，有出血倾向的疾病如血友病患者、产妇和孕妇禁用
过敏反应	①少数患者可出现荨麻疹、血管神经性水肿、过敏性休克 ②可诱发“阿司匹林哮喘” ③哮喘、鼻息肉及慢性荨麻疹患者禁用阿司匹林
水杨酸反应	①剂量过大(5g/d)时，可出现头痛，眩晕，恶心，呕吐，耳鸣，视、听力减退，称为水杨酸反应 ②严重者可出现过度呼吸、酸碱平衡失调甚至精神错乱，应立即停药，碳
瑞夷(Reye)综合征	病毒性感染伴有发热的 儿童或青年 服用阿司匹林后偶可出现肝脂肪变性-肝病综合征
肾损害	于少数人，特别是老年人，伴有心、肝、肾功能损害者

3. 不良反应

(二)对乙酰氨基酚-----扑热息痛

1. 药理作用

- (1) 解热镇痛在中枢神经系统，对乙酰氨基酚抑制前列腺素合成，产生解热镇痛作用。
- (2) 抗炎作用在外周组织，对 COX 没有抑制作用，因此无明显抗炎作用。

1. 临床应用 主要用于解热镇痛。由于对乙酰氨基酚无明显肠胃刺激作用，故对不宜使用阿司匹林的头痛发热患者，适用本药。

2. 不良反应过量中毒可引起肝损害；长期大量用药，引起镇痛药性肾病。

第十五节钙拮抗药

一、钙拮抗药

(一)钙拮抗药的分类和代表药

	类型	代表药物
选择性钙拮抗药	二氢吡啶类	硝苯地平、尼莫地平、尼群地平、氨氯地平等
	苯烷胺类	维拉帕米、加洛帕米
	苯并噻氮卓类	地尔硫卓、克化硫卓等。
非选择性钙拮抗药		普尼拉明、苻普地尔、卡罗维林和氟桂嗪等。

(二)临床应用

药物	临床应用
二氢吡啶类	适用于严重的高血压
维拉帕米、地尔硫卓	适用于轻、中度高血压、不稳定型心绞痛
硝苯地平	为变异型心绞痛首选
维拉帕米	为阵发性室上性心动过速首选
尼莫地平、氟桂利嗪	为脑血管疾病首选

第十六节治疗充血性心力衰竭的药物

1. ACE I 类——减少血管紧张素 II 的生成减少缓激肽的降解、血管舒张、逆转心肌肥厚、逆转心室肥厚，对肾脏有保护作用，增加肾血流量对高血压合并糖尿病、急性心梗、心衰患者尤为适用
2. 利尿剂——（呋塞米）抑制钠钾氯的转运
3. 强心苷（西地兰）：正性肌力、负性频率作用、减慢心室传导、是心衰+房颤，心衰+心腔扩大绝对首选
4. 不良反应：最常见的是室早二联律，最特征性的心律失常是快速房颤+房室传导阻滞 洋地黄中毒：窦性心动过缓或视觉异常黄视绿视立即停药
 洋地黄中毒处理：**血钾低-----补钾**
 血钾不低----- 苯妥英钠或者利多卡因
 缓慢心律失常—阿托品绝对不能用电复律
5. 心衰+高血压急症用硝普钠
6. 禁忌症：肥厚狭窄、急心梗、心率慢、心动过缓预激征低钾外加重阻滞

第十七节抗心绞痛药

1. 硝酸甘油：①扩张静脉血管降低心肌耗氧量
 ②扩张冠状动脉增加心肌缺血灌注
 ③最主要机制—释放 NO、舒张血管平滑肌、保护心肌细胞、治疗心绞痛。
1. B 受体阻断药：代表药——普萘洛尔、降低心肌耗氧量、改善心肌供血。
 变异性心绞痛绝对禁用，因会加重冠脉痉挛。
 治疗心绞痛时和硝酸甘油合用既能减少不良反应，又能明显降低心肌耗氧量。
1. 钙离子拮抗剂：变异性心绞痛的首选

第十八节抗心律失常药

二、抗心律失常药

（一）抗心律失常药的分类

分类	代表药物	作用机制	
I 类（钠通道阻滞药）	Ia 类	奎尼丁、普鲁卡因胺	适度抑制 Na ⁺ 内流，减慢传导，延长复极
	Ib 类	利多卡因、苯妥英钠	轻度抑制 Na ⁺ 内流，促进 K ⁺ 外流
	Ic 类	普罗帕酮、氟卡尼	明显阻滞 Na ⁺ 内流，减慢传导
II 类（B 肾上腺素受体阻断药）	普萘洛尔	抑制 Ca ²⁺ 内流，促进 K ⁺ 外流	
III 类（选择性延长复极的药）	胺碘酮	抑制 Ca ²⁺ 内流，抑制 Na ⁺ 内流；抑制 3 期 K ⁺ 外流	
IV 类（钙拮抗药）	维拉帕米、地尔硫卓	抑制 Ca ²⁺ 内流	

类型	药物	机制	临床应用	不良反应
HMG-CoA 还原酶抑制剂	洛伐他汀 普伐他汀	抑制 HMG-Co A 还原酶 降低 TC 和 LDL	①高胆固醇血症②糖尿病、肾性高脂血症	①横纹肌溶解 ②肝损伤

贝特类 (助理不考)	非诺贝特	抑制 HMG-COA 还原酶 降低 T C 和 LDL	高三酰甘油血症	
---------------	------	------------------------------------	---------	--

第二十章 抗高血压药

1. ACEI 类: (ACEI 抑制 ACE 活性, 使血管紧张素 II (Ang II) 的生成减少, 使血管舒张。)

血管紧张素转换酶抑制剂舒张血管* * 普利

2. 利尿药: 排水常用吩噻嗪类如: 呋塞米

3. β 受体阻断剂: 抑制心肌收缩* * 洛尔

4. 钙拮抗剂 CCB: (钙拮抗药通过减少细胞内钙离子含量而松弛血管平滑肌, 进而降低血压。) 减少钙离子抑制心肌收缩* * 地平

5. ARB: 血管紧张素 II 拮抗剂降低外周阻力* * 沙坦

第二十一章 利尿药

利尿剂的临床应用、禁忌症

	呋塞米	氢氯噻嗪	螺内酯
功能	高效(排 K 利尿剂)	中效(排 K 利尿剂)	低效(保 K 利尿剂)
作用部位	近曲小管髓袢升支粗段	远曲小管近端	远曲小管远端和集合管
作用机制	抑制 Na ⁺ -2Cl ⁻ 转运体	抑制 Na ⁺ -Cl ⁻ 转运体	拮抗醛固酮受体
临床首选	①严重水肿尤其肺水肿、脑水肿+心衰②肾衰	轻中度水肿、高血压 尿崩症	醛固酮引起的顽固性水肿
ARD与禁忌	①水与电解质紊乱(强心苷不合用) ②耳毒性(氨基糖苷类不合用)③高尿酸症(痛风患者禁用)	①低钾、钠镁高钙②高尿酸症③高血糖、高脂血④过敏反应	①高血钾 ②性激素样副作用

第二十二章 作用于血液及造血器官的药物

一、作用于血液及造血器官的药物

(一) 肝素

1. 药理作用

(1) 抗凝作用: 在体内、体外肝素均有强大的抗凝作用。静脉注射后, 抗凝作用立即发生, 可使多种凝血因子灭活。肝素的抗凝作用主要依赖于抗凝血酶 III (AT-III)。

(2) 调脂作用: 使血管内皮细胞释放脂蛋白酯酶, 水解血中的乳糜微粒和 VLDL 而发挥调脂作用。

(3) 抗炎作用: 抑制炎症介质活性和炎细胞活动发挥抗炎作用。

(4) 抗血管内膜增生: 抑制血管平滑肌的增殖。

(5) 抑制血小板聚集: 抑制凝血酶产生的间接作用。

肝素和香豆素的区别

药物	抗凝机制	特点	临床应用	解毒
肝素	增强 ATIII 对凝血因子的灭活	体内、外均有效	①血栓栓塞性疾病; ②DIC 早期;	鱼精蛋白

			③防治 心梗、脑梗 等	
香豆素类	对抗 VitK, 影响凝血因子 II、VII、IX、X 的合成	体内有效	防治 血栓性 疾病	维生素 K

十五、组胺受体阻断药

1. H₁ 受体阻断药:阻断 H₁ 受体

代表药物:**扑尔敏**(氯苯那敏)、苯海拉明、氯雷他定(息斯敏)——①皮肤黏膜过敏的首选治疗②治疗晕动病引起的呕吐

2. H₂ 受体阻断药:对皮肤黏膜过敏无效,阻胃壁的 H₂ 受体——抑酸作用* * 替丁抑酸治疗消化性溃疡

第二十三节 组胺受体阻断药

类型	代表药物	机制	临床应用
H ₁ 受体阻断剂	氯苯那敏 (异丙嗪苯海拉明)	①阻断 H ₁ 受体 ②抗中枢作用: 镇静、嗜睡 ③抗胆碱作用	①抗过敏②中枢抑制作用③止吐、防晕
	氯雷他定	阻断 H ₁ 受体无抗胆碱作用和中枢抑制作用	对抗组胺引起的过敏
H ₂ 受体阻断剂	雷尼替丁	阻断壁细胞膜的 H ₂ 受体	对基础胃酸分泌的作用较强

第二十四节 作用于呼吸系统药

一、作用于呼吸系统

(一) 抗炎平喘药

1. 糖皮质激素药理作用 通过抑制哮喘时炎症反应的多个环节发挥平喘作用

(1) 抑制多种参与哮喘发病的炎性细胞和免疫细胞。

(2) 抑制细胞因子和炎症介质的产生,抑制免疫系统功能和抗过敏作用:减少组胺、5-羟色胺、缓激肽等过敏介质释放。

(3) 抑制气道高反应性。

(4) 增强支气管以及血管平滑肌对儿茶酚胺的敏感性。

2. 糖皮质激素临床应用

(1) 用于支气管扩张药不能有效控制病情的慢性哮喘患者,长期应用可以减少或中止发作,减轻病情严重程度,但不能缓解急性症状。

(2) 气雾吸入糖皮质激素可减少口服激素制剂用量或逐步替代口服激素。

(二) 支气管扩张药

1. 沙丁胺醇

(1) 药理作用:为 β₂ 受体激动剂,通过兴奋气道平滑肌和肥大细胞膜表面的 β₂ 受体,舒张气道平滑肌、减少肥大细胞和嗜碱性粒细胞脱颗粒及其介质的释放、降低微血管的通透性、增加气道上皮纤毛的摆动等缓解哮喘症状。

2. 特布他林

(1) 药理作用:特布他林作用与沙丁胺醇相似。

3. 氨茶碱的药理作用、作用机制及临床应用

(1) 药理作用及作用机制 具有平喘、强心、利尿、扩张血管和中枢兴奋等作用,平喘机制如下:①抑制**磷酸二酯酶**;②阻断腺苷受体;③增加内源性儿茶酚胺的释放;④免疫调节与

抗炎作用；⑤增加膈肌收缩力并促进支气管纤毛运动。

第二十五节 作用于消化系统药物

作用于消化系统的药物

(一) 抑制胃酸分泌药

1. **奥美拉唑** (洛赛克) 药理作用 奥美拉唑具有强大而持久的**抑制胃酸分泌**作用

(1) 抑制 H^+-K^+-ATP 酶：奥美拉唑是抑制胃酸药中最强、最有效的。

(2) 促进胃泌素分泌作用：由于胃酸分泌受抑制，可反馈性抑制胃泌素的分泌。

(3) 保护胃黏膜的作用：本类药可使胃蛋白酶产生减少，显著保护胃黏膜。

(2) 抗幽门螺杆菌 (Hp) 作用。

2. 临床应用 主要用于消化性溃疡、食管反流病、上消化道出血、抗 Hp 感染卓艾综合征等，对阿司匹林、乙醇、应激所致的胃黏膜损伤有预防保护作用。

3. 不良反应 不良反应较少，偶见恶心、呕吐、腹胀便秘、腹泻等、头痛、皮疹等。

(1) 与华法林、地西泮、苯妥英钠等药合用，可使上述药物体内代谢减慢 (抑制肝药酶)。

(2) 慢性肝病有肝功能减退者，用量宜酌减。

(3) 长期服用者，应定期检查胃黏膜有无肿瘤样增生。

第二十六节 肾上腺皮质激素类药物

糖皮质激素

一、作用：**四抗、三多、两少**

1. **四抗**：①抗炎②抗毒(内毒素)③抗休克④抗免疫

2. **三多**：红细胞、中性粒细胞、血小板多

3. **两少**：淋巴细胞、嗜酸性粒细胞少

二、对代谢的影响

升糖、解蛋、移脂、升血、保钠排钾排水、降血钙

三、临床应用

①替代疗法(小剂量皮质功能低下)②自身免疫性疾病和过敏性疾病③严重感染或炎症(糖皮+抗生素)④抗休克(感染性休克)⑤血液病(急淋、再障)器官移植排异⑥其他：皮炎、湿疹等⑦允许作用退热作用

四、不良反应

1. 长期应用致停药反应(反跳现象)

2. 皮质功能亢进：库欣综合征(向心性肥胖)

3. 运动系统疾病：骨质疏松、肌肉萎缩伤口愈合延迟

4. 5 个诱发：①感染②溃疡出血、穿孔③精神病、癫痫等

④高血压、动脉粥样硬化⑤糖尿病

五. 代表药物：

①**泼尼松**——需经肝脏代谢形成有活性的泼尼松龙肝病病人禁用泼尼松直接用泼尼松龙

②**地塞米松**——激素中对水钠潴留作用最弱抗炎作用最强

药物	机制	临床应用	不良反应
硫脲类(丙硫氧嘧啶、甲巯咪唑)	抑制甲状腺过氧化物酶的合成 ↓ 从而减少 T_3 、 T_4	①甲亢的内科治疗 ②甲亢术前准备 ③甲状腺危象的治疗	①常见：过敏、胃肠道反应 ②严重：粒细胞缺乏症

			停药指征: $WBC < 3 \times 10^9$
碘及碘化物	①小剂量: 促 T ₃ 、T ₄ 的合成 ②大剂量: 抑制甲状腺的释放	①甲亢术前准备 ②甲状腺危象的治疗	①一般反应 ②诱发甲状腺功能紊乱

第二十八节 胰岛素及口服降糖药

类型	药物	机作用	临床应用	AD R
	胰岛素	降糖、升脂、升蛋白	① I 糖尿病 ②伴有酮症酸中毒或高渗性昏迷 ③2 型糖尿病饮食或口服未能控制血糖 ④合并重症感染、高热、妊娠等	①低血糖 ②过敏反应 ③胰 岛素抵抗 ④脂肪萎缩
促胰岛素释放剂	(磺酰脲类) 格列××	促进胰岛细胞释放胰岛素	①2型糖尿病非肥胖首选 ②尿崩症(氯磺丙酰)	低血糖
胰岛素增敏剂(助)	罗格列酮 吡格列酮	激活过氧化物酶增殖体活化因子受体	①改善胰岛素抵抗 ⁺ 降血糖 ②2 型糖尿病	水肿
双胍类	二甲双胍	①促进脂肪组织摄取葡萄糖 ②降低葡萄糖的吸收	轻症糖尿病 ⁺ 尤其是肥胖的糖尿病	消化道反应 乳酸酸中毒
α - 糖苷酶抑制剂(助)	阿卡波糖	①抑制 α - 糖苷酶 ⁺ 降低碳水化合物的降解为糖 ②延缓葡萄糖的吸收	餐后血糖高的	腹胀、腹泻

第二十九—三十三节 抗生素类药

	青霉素 G	氨苄西林	阿莫西林
高度敏感菌	① G ⁺ 球菌: 溶血性链球菌、肺炎球菌、草绿色链球菌、金葡菌等 ②G ⁻ 球菌: 脑膜炎和淋病奈瑟菌 ③G ⁺ 杆菌: 白喉棒状杆菌、炭疽杆菌、产气荚膜杆菌、破伤风杆菌 ④G ⁻ 杆菌: 流感杆菌、百日咳鲍特菌 ⑤螺旋体: 梅毒、钩端、回归热螺旋体	G ⁻ 菌: 伤寒沙门菌 副伤寒沙门菌 百日咳鲍特菌 大肠埃希菌 痢疾志贺菌 G ⁻ 球菌: 粪链球菌	与氨苄西林类似 但对肺炎球菌、肠球菌、沙门菌属、Hp 的杀菌作用比氨苄西林强
不敏感菌	①对肠球菌不敏感 ②对真菌、原虫、立克次体、病毒等无作用	对铜绿假单胞菌无效	对铜绿假单胞菌无效

临床首选	敏感的 G ⁺ 球菌和 G ⁺ 杆菌、G ⁻ 球菌及螺旋体所致的感染	敏感菌所致的呼吸道、伤寒、副伤寒、尿路感染、胃肠道感染、败血症等	敏感菌所致的呼吸道、尿路感染、胆道感染、及慢性活动性胃炎和消化性溃疡的治疗
------	---	----------------------------------	---------------------------------------

药物类型	代表药物	G ⁺ 菌	G ⁻ 菌	绿铜假单胞菌	肾毒性	不良反应
第一代	头孢噻吩 头孢氨苄 头孢拉定	强	弱	无效	大	①过敏性休克 ②双硫仑反应 ③牙龈出血 (维生素K的缺乏)
第二代	头孢呋辛 头孢孟多	弱	强	无效	小	
第三代	头孢曲松 头孢他啶 头孢哌酮	较弱(较一、二代弱)	强	有效	无	
第四代	头孢噻肟 头孢匹罗	强	强	有效	无	

抗菌作用	①对各种需氧 G ⁻ 杆菌有强大抗菌活性，如大肠埃希菌、铜绿假单胞菌、变形杆菌属、克雷伯菌属、肠杆菌属、志贺菌属、枸橼酸杆菌属等。 ②对 G ⁻ 球菌抗菌作用差，如淋病奈瑟菌、脑膜炎奈瑟菌等。 ③对 MASA 和 MASE 有较好的抗菌活性。 ④对肠球菌和厌氧菌不敏感。
抗菌机制	抑制细菌蛋白质合成，破坏细胞质膜的完整性
不良反应	1. 耳毒性 ：对前庭神经和耳蜗神经损伤，尤其在儿童和老人更易引起。 (1) 前庭神经损害 ：表现为头昏、视力减退、眼球震颤、眩晕、共济失调；发生频率依次：新霉素 > 卡那霉素 > 链霉素 > 西索米星 > 阿米卡星 > 庆大霉素 (2) 耳蜗听神经损害 ：耳鸣、听力减退、永久性耳聋。 ③发生频率：新霉素 > 卡那霉素 > 链霉素 > 西索米星 > 阿米卡星 > 庆大霉素 该毒性还能影响子宫内胎儿。 2. 肾毒性 ：常引起肾小管肿胀，重则急性坏死。表现为：蛋白尿、管型尿、血尿等，严重可致无尿、氮质血症、肾衰竭。 发生频率依次：新霉素 > 卡那霉素 > 庆大霉素 > 妥布霉素 > 阿米卡星 > 链霉素。 3. 神经肌肉麻痹 ：可引起心肌抑制、血压下降、肢体瘫痪和呼吸衰竭。 4. 超敏反应 ：皮疹、发热、血管神经炎、口周发麻等。新霉素——接触性皮炎；链霉素——过敏性休克，发生率仅次于青霉素。

庆大霉素	①治疗各种 G ⁻ 杆菌，为氨基糖苷类的首选药物。 ②与青霉素协同治疗肺炎球菌、铜绿假单胞菌、肠球菌葡萄球菌的感染。
-------------	--

妥布霉素	铜绿假单胞菌感染首选妥布霉素。
阿米卡星	突出优点是对肠道 G-杆菌和铜绿假单胞菌所产生的多种氨基糖苷类灭活酶较稳定，但对 氨基糖苷类耐药能控制有效 ，常作为临床首选。

第三十四节 抗结核药

抗结核药

(一) 异烟肼

1. 临床应用 适用于各种类型的结核病，除早期轻症肺结核或预防应用外，均宜与其他一线药物联合应用。对急性粟粒性结核和结核性脑膜炎应增大剂量，必要时采用静脉滴注。

(二) 利福平

1. 临床应用

(1) 利福平与其它抗结核药联合使用可治疗各种类型的结核病，包括初治及复发患者。与异烟肼合用治疗初发患者，与乙胺丁醇及噻嗪酰胺合用治疗复发患者。

(2) 也用于治疗麻风病、耐药金葡菌及其他敏感细菌所致的感染。

(3) 因利福平在胆汁中浓度较高，因此可用于重症胆道感染。

(4) 利福平可局部用于沙眼、急性结膜炎、病毒性角膜炎的治疗。

(三) 乙胺丁醇

1. 药理作用：乙胺丁醇对繁殖期结核杆菌有较强的抑作用。乙胺丁醇对其他细菌无效，单独使用可产生耐药性。常与其它抗结核药联合使用，无交叉药现象。乙胺丁醇会引起球后视神经炎的发生。

2. 临床应用 用于各型肺结核和肺外结核。与异烟肼合用治疗初治患者，与利福平和卷曲霉素合用治疗复治患者。特别适用于经链霉素和异烟肼治疗无效的患者。

(四) 吡嗪酰胺

1. 药理作用 在酸性环境下对结核杆菌有较强的抑制和杀灭作用

2. 临床应用 单用易产生耐药性，常与异烟肼、利福平合用治疗结核病。

第三十五节 控制疟疾发作的药物

代表药物	氯喹	青蒿素	伯氨喹	乙胺嘧啶
类型	控制症状的药物	控制症状的药物	控制复发和传播药物	病因预防性药物
主要杀灭	红细胞期内杀灭作用	红细胞内期杀灭作用	对间日疟和卵圆形疟对肝细胞内休眠期的疟原虫有杀灭作用	控制疟原虫的增值
无效	对子孢子、休眠子和配子体均无效	对红细胞外期无效	对红细胞内期无效，	对已发育成熟的裂殖体无效
临床应用	①能迅速有效控制疟疾的临床发作； ②不能用于病因预防（蚊体内）、控制远期复发（肝细胞内）及传播。 ③抗肠道外阿米巴	③能迅速有效控制疟疾的临床发作； ②用于耐氯喹或多耐药性的恶性疟。③因可透过血脑屏障，故用于脑型疟的抢救	防治疟疾远期复发的主要药物，与红细胞内期抗疟药物合用，能根治良性疟疾，可阻断疟疾传播	常用于病因预防不能直接杀灭配子体，但能阻止疟原虫在蚊体内的发育
不良	罕见	罕见	高铁血红蛋白血症	巨红细胞性贫血

反应			急性溶血	粒细胞减少
----	--	--	------	-------

第三十五节 抗肿瘤药

(一) 抗肿瘤药物的分类

	抗肿瘤的生化机制	举 例
干扰核酸 (DNA、 RNA) 合成	特异性干扰核酸代谢（主要作用于S期），组织细胞的分裂和繁殖	二氢叶酸还原酶抑制剂——甲氨蝶呤 腺苷酸合成酶抑制剂——氟尿嘧啶 嘌呤核苷酸互变抑制剂——巯嘌呤 核苷酸还原酶抑制剂——羟基脲 DNA多聚酶抑制剂——阿糖胞苷
破坏DNA结 构与功能	破坏DNA结构或抑制拓扑异构酶，影响DNA结构和功能	DNA交联剂——氮芥、环磷酰胺、噻替派 破坏DNA的铂类——顺铂 拓扑异构酶抑制剂——喜树碱类
嵌入DNA及 干扰转录 RNA	干扰转录过程，阻止mRNA合成	DNA嵌入剂——多柔比星、放线菌素D
干扰蛋白 质合成	干扰微管蛋白聚合功能，干扰核蛋白体的功能，抑制蛋白质合成	微管蛋白活性抑制剂——长春新碱、紫杉醇碱 干扰核糖体功能药——三尖杉生物碱类 影响氨基酸供应药——L-门冬酰胺酶

(二) 常用药物

常用药物	临 床 应 用
甲氨蝶呤	儿童急性白血病、绒毛膜上皮癌；鞘内注射治疗中枢神经系统白血病
氟尿嘧啶	消化系统癌 (食管癌、胃癌、肠癌、胰腺癌、肝癌)、 乳腺癌疗效好 对宫颈癌、卵巢癌、绒癌、膀胱癌、头颈部肿瘤也有效
巯嘌呤	急性淋巴细胞白血病的维持治疗、绒癌
羟基脲	对慢性粒细胞性白血病有 显著疗效 ，对黑色素瘤可暂时缓解
环磷酰胺	恶性淋巴瘤疗效显著；对多发性骨髓瘤、急淋白血病、肺癌、乳腺癌、卵巢癌、神经母细胞、睾丸肿瘤有一定疗效
阿霉素	急性白血病、淋巴瘤、乳腺癌、肺癌等