**★考点 1　药物效应动力学**

1. 各药物反应的特点

|  |  |
| --- | --- |
| 副反应 | 是在治疗剂量下发生的，是药物本身的固有作用，难以避免 |
| 毒性反应 | 剂量使用过大(超量)，慢性蓄积过多，可以避免 |
| 变态反应 | 过敏体质容易发生，首次用药很少发生，过敏性终身不退，结构相似药物有交叉过敏 |
| 特异反应 | 机体用药后少数病人因机体生化机制的异常而出现的特异性不良反应 |

　　2.LD 50 / ED 50 的比值称为治疗指数，是药物的安全性指标。 此值越大越安全。

　　3.药物与受体

　　(1)药物与受体的结合能力，称为亲和力，它决定药物的作用强度。 (结合能力)

(2)药物与受体结合后产生最大效应的能力，称为内在活性。 (结合后产生效果的能力)

|  |  |
| --- | --- |
| 完全激动药 | 具有较强亲和力和较强内在活性(α＝１)如吗啡 |
| 部分激动药 | 有较强亲和力，但内在活性不强(α<１)ꎬ如喷他佐辛 |
| 激动药 | 既能与受体结合，同时产生相应效果 |
| 拮抗药 | 能与受体结合，但不能产生效果(α＝０)，如纳洛酮、普萘洛尔 |

**★考点 2　药物代谢动力学**

　　1.从胃肠道(口服)吸收进入门静脉系统的药物在到达全身血循环前必先通过肝脏，如果肝脏对其代谢能力很强，或由胆汁排泄的量大，则使进入全身血循环的有效药物量明显减少，这种作用称为首关消除，也称首关代谢。 首关消除，主要途径是口服，舌下和直肠给药可以避免首关消除。

　　2.易于穿过血脑屏障分布至脑组织产生中枢效应的药物———分子小、脂溶性大、低血浆蛋白结合率。 治疗脑病可以选用极性低的脂溶性药物。 血脑屏障对于脂溶性低、分子量大的药物起到阻挡保护作用。 但胎盘屏障形同虚设。 母体用药基本均能透过胎盘屏障，所以临床孕妇用药，应该特别注意。

　　3.静脉用药，生物利用度为 100%，口服用药生物利用度可能<100%。

　　4.一级消除动力学———等比，零级消除动力学———等量。

　　5.每隔一个 t 1/ 2 给药一次，则体内血药浓度可逐渐累积，经过 5 个 t 1/ 2 后，达到稳态。

**★考点 3　各种代表药物**

　　1.N 样作用:骨骼肌收缩。

　　2.M 样作用:心脏抑制、血管扩张、腺体分泌、平滑肌收缩、瞳孔缩小。

　　3.毛果芸香碱:缩瞳、降低眼压、调节痉挛(看近不看远———近视)ꎻ阿托品:扩瞳、升高眼压、调节麻痹(看远不看近———远视)ꎻ中毒互救:毛果芸香碱可以解救阿托品中毒，阿托品可以解救毛果芸香碱中毒。

　　4.急性有机磷酸酯类中毒的治疗:阿托品+解磷定(黄金搭档)。 有机磷酸酯类中毒的解救———用碱性溶液洗胃或冲洗皮肤，但敌百虫遇碱性溶液会变成敌敌畏，毒性更强，故不用碱性溶液。

1. 记忆口诀

|  |  |
| --- | --- |
| 去甲肾上腺素 | 去甲强烈缩血管ꎬ升压作用不翻转ꎬ只能静滴要缓慢ꎬ引起肾衰很常见ꎬ用药期间看尿量ꎬ休克早期用间羟胺 |
| 肾上腺素 | α、β 受体兴奋药，肾上腺素是代表，血管收缩血压升，局麻用它延时间，局部止血效明显，过敏休克当首选，心脏兴奋气管扩，哮喘持续它能缓，心跳骤停用“三联”ꎬ应用注意心血管，α受体被阻断，升压作用能翻转 |

　　6.青霉素是治疗草绿色链球菌心内膜炎、A 组和 B 组溶血性链球菌感染、敏感葡萄球菌感染、气性坏疽、梅毒、鼠咬热等的首选药。

　　7.β 受体阻断药

|  |  |
| --- | --- |
| 记忆口诀 | β受体阻断药，普萘洛尔是代表ꎬ临床治疗高血压，心律失常心绞痛ꎮ 三条禁忌记心间，哮喘、心力衰竭、心动缓 |
| 临床应用 | 快速型心律失常，心绞痛和心肌梗死，高血压，充血性心力衰竭，其他———焦虑，甲状腺功能亢进症，嗜铬细胞瘤、肥厚性心肌病，青光眼 |
| 不良反应 | 心脏抑制，诱发或加重支气管哮喘，反跳现象 |
| 禁用 | 严重左室心功能不全、窦性心动过缓、重度房室传导阻滞和支气管哮喘 |

　　8.酚妥拉明的临床应用:抗休克，外周血管痉挛性疾病，肾上腺嗜铬细胞瘤的诊断和治疗，急性心肌梗死和顽固性充血性心力衰竭，治疗去甲肾上腺素外漏，治疗肾上腺素所致的高血压，突然停用可乐定(中枢降压药)后出现的高血压危象。

　　9.局麻药类型

|  |  |
| --- | --- |
| 利多卡因 | 主要用于传导麻醉和硬膜外麻醉，本药也可用于心律失常的治疗，对普鲁卡因过敏者可选用此药 |
| 丁卡因 | 对黏膜的穿透力强，常用于表面麻醉，因毒性大，一般不用于浸润麻醉 |

　　10.地西泮是目前用作癫痫持续状态的首选药。

11.治疗癫痫的药物

|  |  |
| --- | --- |
| 卡马西平 | 又称酰胺咪嗪，是治疗单纯性局限性发作和大发作的首选药物之一 |
| 乙琥胺 | 在临床作为小发作(失神性发作)首选用药 |
| 丙戊酸钠 | 为一种广谱抗癫痫药，临床上对各类型癫痫都有一定疗效，它是大发作合并小发作时的首选药物 |

　　12.中枢性尿崩症首选弥凝，非中枢性尿崩症首选卡马西平、氯磺丙脲、氢氯噻嗪。

　　13.氯丙嗪小剂量可抑制催吐化学感受区，大剂量直接抑制呕吐中枢，对多种药物(如洋地黄、吗啡、四环素等)和疾病(如尿毒症、恶性肿瘤)引起的呕吐具有显著镇吐作用，但不能对抗前庭刺激引起的呕吐(晕动病)。

　　14.各精神疾病的首选药物

　　精神分裂症———氯丙嗪ꎻ抑郁症———丙咪嗪(米帕明)ꎻ躁狂症———碳酸锂。

　　15.哌替啶的禁忌证与吗啡相同，禁用于分娩止痛、哺乳妇女止痛、支气管哮喘及肺源性心脏病患者，颅脑损伤所致颅内压增高的患者、肝功能严重减退患者及新生儿和婴幼儿禁用。

1. 阿司匹林的临床应用

|  |  |
| --- | --- |
| 解热镇痛及抗风湿 | 用于头痛、牙痛、肌肉痛、痛经及感冒发热等，迅速缓解风湿性关节炎的症状ꎮ |
| 影响血小板的功能 | 低浓度能减少血小板中血栓素，Ａ２ (ＴＸＡ ２ )的生成———影响血小板的聚集及抗血栓形成———抗凝———治疗各种原因导致的血栓形成ꎮ |

1. 钙离子拮抗剂

|  |  |
| --- | --- |
| 二氢吡啶类 | 硝苯地平———心率较慢的患者(高血压、心绞痛、脑血管病)，增快心率 |
| 非二氢吡啶类 | 维拉帕米———心率过快的患者(高血压、心绞痛、脑血管病)，降低心率ꎬ严重传导阻滞的禁用，阵发  性室上性心动过速首选药 |

　　18.强心苷正性肌力作用:增加心肌收缩力。 与心肌细胞膜上的强心苷受体 Na +-K+ -ATP 酶结合并抑制其活性，胞内 Na + 量增多，进而通过 Na +-Ca2+双向交换机制使心肌细胞内 Ca2+增加。

　　19.地高辛的主要药理作用是:强心、减慢心率、抑制房室传导、利尿———一正二负三利尿。

　　20.钙拮抗药:变异型心绞痛———最佳适应证ꎻ稳定型心绞痛及急性心肌梗死也有效。

　　21.他汀类药物能抑制肝脏合成胆固醇的限速酶 HMG-CoA 还原酶活性。 临床应用:原发性高胆固醇血症。他汀类药物偶有横纹肌溶解症。

　　22.贝特类药物能明显降低患者血浆 TG、VLDL、IDL 含量，而使 HDL 升高。 对高甘油三酯为主的高酯血症患者，效果明显。

1. 利尿剂的类型

|  |  |
| --- | --- |
| 排Ｎａ＋排Ｋ＋利尿剂 | 呋塞米、氢氯噻嗪，会导致低钾血症 |
| 排 Ｎａ ＋ 保 Ｋ ＋ 利尿剂 | 螺内酯，会导致高钾血症 |

　　25.奥美拉唑(洛赛克):抑制 H +-K+ -ATP 酶，是抑制胃酸药中最强、最有效的。 奥美拉唑有抗幽门螺杆菌作用。 是反流性食管炎、胃溃疡的首选药物。

1. 糖皮质激素记忆口诀:激素复杂但易记，密码 54321，一进一退五诱发，四种给法要熟悉。

|  |  |
| --- | --- |
| ５ | 五抗(抗炎、抗毒、抗休克、抗免疫、抗血液系统疾病) |
| ４ | 四大代谢(蛋白、脂肪、糖、水盐) |
| ３ | 三大系统(神经、消化、循环) |
| ２ | 两类组织(肌肉、骨) |
| １ | 一个负反馈(肾上腺皮质反馈轴) |
| 一进 | 医源性肾上腺皮质功能亢进 |
| 一退 | 肾上腺皮质功能减退 |
| 五诱发 | 诱发加重感染，诱发溃疡、糖尿病、精神病、高血压 |
| 四种给药法 | 小剂量代替，一般剂量长程，大剂量突击疗法，隔日疗法 |

　　27.氟康唑:治疗艾滋病患者隐球菌性脑膜炎的首选药。