《药学基础综合》考试大纲

《药学基础综合》包括《有机化学》、《分析化学》和《药理学》三部分内容。

第一部分 《有机化学》

指定参考书:

陆涛主编. 《有机化学》(供药学专业用) 人民卫生出版社 第 8 版 陆涛主编. 《有机化学学习指导与习题集》 人民卫生出版社 第 4 版 考试内容:

第一章 绪论

第二节 有机化合物的结构共价键

- 一、凯库勒结构理论
- 二、化学键

第三节 共价键的几个重要参数和断裂方式

- 一、几个重要参数
- 二、共价键的断裂方式

第四节 有机化合物的分类和表示方法

一、按官能闭分类

第五节 有机酸碱概念

一、路易斯酸碱

第二章 烷烃

第一节 分类、构造异构和碳原子的级

- 一、烷烃的构造异构和命名
- 二、碳原子的级

第二节 命名

- 一、普通命名法
- 二、系统命名法
- 1、直链烷烃的命名
- 2、支链烷烃的命名
- 3、复杂支链烷烃的命名
- 4、环烷烃的系统命名

第四节 构象

第六节 烷烃的化学反应

- 一、甲烷的卤代反应
- 二、甲烷卤代的反应机理
- 三、其他烷烃的卤代反应

第三章 烯烃

- 第一节 结构、同分异构和命名
- 一、烯烃的结构
- 二、同分异构
- 三、命名
- 四、顺反异构的命名
- 第三节烯烃的化学性质
- 一、亲电加成反应
- 二、自由基加成
- 三、硼氢化反应
- 四、氧化反应
- 五、α-Η 的反应
- 第四节 烯烃的制备

第四章 炔烃和二烯烃

- 第一节 炔烃的分类、结构和命名
- 一、炔烃的结构
- 二、炔烃的命名
- 第三节 炔烃的化学性质
- 一、炔氢的反应
- 二、碳碳叁键的反应
- 第四节炔烃的制备
- 一、二卤代烃脱卤素
- 二、伯卤代烃和炔化钠反应
- 第五节 二烯烃
- 一、分类和命名
- 二、共轭烯烃的结构--π-π共轭

- 三、共轭二烯烃的特征反应
- 1、共轭加成
- 2、狄尔斯-阿尔德反应
- 四、聚集二烯烃
- 五、共轭效应

第五章 脂环烃

第一节 分类和命名

第三节 构象 Conformation

- 一、环丙烷、环丁烷和环戊烷的构象
- 二、环己烷的构象

第四节 环烷烃的化学反应

第五节 脂环烃的制备

第六章 立体化学基础

第一节 概述

- 一、平面偏振光及比旋光度
- 二、对映异构和手性
- 三、分子的对称性和手性

第二节 对映异构和非对映异构

- 一、含一个手性碳原子的化合物
- 二、含多个手性碳原子的化合物

第三节 取代环烷烃的立体异构

- 一、取代环烷烃的构型异构
- 二、取代环己烷的构象分析
- 三、二环环烷烃的构象

第四节 旋光异构在研究反应机理中的应用

- 一、自由基卤代反应
- 二、卤素与烯烃的加成反应

第七章 芳香烃

第一节 芳烃的分类和命名

第二节 苯的结构

- 一、苯的 Kekule 结构式
- 二、芳香六隅体

第四节 苯及其同系物的化学性质

- 一、苯环上的亲电取代反应
- 二、取代苯的亲电取代反应的定位规律
- 三、苯的加成和氧化反应
- 四、烷基苯侧链的反应

第五节 多环芳烃与非苯芳香烃

- 一、萘
- 二、蒽、菲和其他稠环芳烃
- 三、联苯
- 四、非苯芳香烃

第八章 卤代烃

第一节 结构、分类和命名

第三节 卤代烃的化学性质

- 一、卤代烷的亲核取代反应
- 二、卤代烷的消除反应
- 三、与金属的反应
- 四、还原反应

第四节 亲核取代反应和消除反应机理

- 一、亲核取代反应机制
- 二、影响亲核取代反应机制的因素
- 三、消除反应机理

四、消除反应与亲核取代反应的竞争

第五节 不饱和卤代烃和芳香卤代烃

- 一、乙烯型和卤苯型卤代烃
- 二、烯丙基型和苄基型卤代烃

第六节 卤代烃的制备

第九章 醇、酚和醚

第一节 醇

- 一、醇的结构、分类和命名
- 二、醇的化学性质
- 三、邻二醇的特性
- 五、醇的制备
- 第二节 酚
- 一、结构、分类和命名
- 二、酚的化学性质
- 三、制备
- 第三节 醚和环氧化合物
- 一、结构、分类和命名
- 二、醚的化学性质
- 三、醚的制备
- 四、环氧化合物
- 第四节 硫醇和硫醚
- 一、硫醇
- 二、硫醚

第十章 醛和酮

- 第一节 结构、分类和命名
- 第三节 醛、酮的化学性质
- 一、亲核加成反应
- 二、α-碳及α-氢的反应
- 三、氧化反应
- 四、还原反应
- 第四节 醛和酮的制备
- 第五节αβ-不饱和醛酮
- 一、结构
- 二、化学性质

第十一章 羧酸和取代羧酸

- 第一节 结构、分类和命名
- 一、羧酸的结构

- 二、羧酸的命名
- 第三节 羧酸的化学性质
- 一、酸性
- 二、羧基中羟基的取代反应
- 三、还原反应
- 四、α-H的反应
- 五、脱羧反应
- 六、二元酸的热解反应
- 第四节、羧酸的制备
- 第五 节取代羧酸
- 一、卤代酸
- 二、羟基酸

第十二章 羧酸衍生物

- 第一节 结构和命名
- 第三节 化学性质
- 一、水解、醇解和氨解
- 二、与有机金属化合物的反应
- 三、还原反应
- 四、酰胺的特性
- 第四节 碳酸衍生物和原酸衍生物
- 一、碳酸衍生物
- 第五节 油脂、磷脂和蜡
- 一、油脂
- 二、磷脂、
- 三、蜡
- 第六节 羧酸衍生物的制备
- 一、羧酸法
- 二、羧酸衍生物法
- 三、贝克曼重排
- 四、拜尔-维立格反应

第十三章 碳负离子

- 第一节 缩合反应
- 一、羟醛缩合型反应
- 二、酯缩合反应
- 第二节 β-二羰基化合物的烷基化、酰基化及在合成中的应用
- 一、乙酰乙酸乙酯
- 二、丙二酸二乙酯
- 三、迈克尔加成

第十四章 有机含氮化合物

- 第一节 硝基化合物
- 一、化学性质
- 第二节 胺类化合物
- 一、胺的结构、分类和命名
- 二、胺的化学性质
- 三、胺的制备
- 第四节 重氮盐和偶氮化合物
- 二、 芳香重氮盐的反应
- 二、偶氮化合物
- 三、重氮甲烷
- 第五节 卡宾
- 一、结构
- 二、化学性质

第十五章 杂环化合物

- 第一节 分类和命名
- 第二节 六元杂环化合物
- 一、吡啶
- 二、喹啉和异喹啉
- 三、含两个氮原子的六元杂环
- 四、含氧原子的六院杂环
- 第三节 五元杂环化合物

- 一、吡咯、呋喃和噻吩
- 二、吲哚
- 三、含两个杂原子的五元杂环
- 四、嘌呤和嘌呤衍生物

第四节 重要的杂环化合物的制备

- 一、喹啉及其衍生物的合成
- 二、嘧啶及其衍生物的合成
- 三、吲哚及其衍生物的合成

第十六章 糖类

第一节 单糖

- 一、结构
- 二、单糖的变旋光现象和环状结构
- 三、单糖的化学性质

第二节 双糖

- 一、麦芽糖
- 二、纤维二糖
- 三、乳糖

四、蔗糖

第四节 多糖

- 一、淀粉
- 二、纤维素
- 三、糖原

第十七章 氨基酸、多肽和蛋白质和核酸

第一节 氨基酸

- 一、氨基酸的结构、分类和命名
- 二、氨基酸的化学性质

第二节 多肽和蛋白质

- 一、多肽的命名与肽键的结构特点
- 二、蛋白质的结构层次与特点

第三节 核酸

- 一、分类
- 二、结构

第十八章 萜类和甾族化合物

- 第一节 萜类
- 一、结构
- 第二节 甾族化合物
- 一、基本骨架及其编号
- 二、命名
- 三、甾族化合物的构型与构象
- 四、胆固醇(胆甾醇)

第二部分 《分析化学》

指定参考书:

柴逸峰, 邸欣主编. 《分析化学》(供药学类专业用). 人民卫生出版社, 第8版 柴逸峰, 邸欣主编. 《分析化学学习指导与习题集》. 人民卫生出版社, 第4版 考试内容:

第一章 绪论

第一节 分析化学的作用

第三节 分析化学的方法分类

- 一、定性分析、定量分析、结构分析和形态分析
- 二、无机分析和有机分析
- 三、化学分析和仪器分析
- 四、常量分析、半微量分析、微量分析和超微量分析
- 五、常量组分分析、微量组分分析和痕量组分分析

第四节 分析过程和步骤

本章重点:分析化学的方法分类

第二章 误差和分析数据处理

第一节 测量值的准确度和精密度

第二节 有效数字及其运算法则

第三节 有限量测量数据的统计处理

本章重点:准确度与精密度;系统误差、偶然误差以及提高分析结果准确度的方法;有效数字;显著性检验的方法。

第三章 滴定分析法概论

第一节 滴定分析法和滴定方式

第二节 标准溶液

第三节 滴定分析中的计算

第四节 滴定分析中的化学平衡

本章重点:选择指示剂的一般原则;标准溶液浓度的表示方法及标准溶液的配制方法;滴定分析中有关计算;分布系数及计算。

第四章 酸碱滴定法

第一节 溶液中酸碱组分的分布

第二节 酸碱溶液中 pH 的计算

第三节 酸碱指示剂

第四节 酸碱滴定法的基本原理

第五节 滴定终点误差

第六节 非水溶液中的酸碱滴定法

本章重点: 化学计量点 pH 的计算; 影响滴定突跃的因素; 各类型酸碱能否被准确滴定以及分步滴定的判断; 滴定酸碱标准溶液的配制和标定、酸碱滴定结果的计算。

第五章 配位滴定法

第一节 配位滴定法的基本原理

第二节 配位滴定条件的选择

本章重点:配合物的稳定常数、副反应系数、条件稳定常数;金属指示剂的变色原理及其必须 具备的条件;单一金属离子测定时酸度的控制;EDTA标准溶液的配制和标定、配位滴定结果的 计算。

第六章 氧化还原滴定法

第一节 氧化还原滴定的基本原理

第二节 碘量法

第三节 高锰酸钾法

第四节 亚硝酸钠法

第五节 其他氧化还原滴定法

本章重点: 碘量法、高锰酸钾法和亚硝酸钠法的基本原理与测定条件、指示剂的选择、标准溶液的配制与标定; 化学计量点电位值的计算; 氧化还原滴定结果的计算。

第七章 沉淀滴定法 第八章 重量分析法

第一节 沉淀滴定法

第二节 重量分析法

本章重点:三种银量法指示滴定终点的原理和条件;晶形沉淀和无定型沉淀的沉淀条件;换算因数的计算。

第十章 光谱分析法概论

第一节 电磁辐射及其与物质的相互作用

第二节 光学分析法的分类

第三节 光谱分析仪器

第四节 光谱分析法的发展概况

本章重点: 光学分析法的分类和基本原理

第十一章 紫外-可见分光光度法

第一节 紫外-可见分光光度法的基本原理和概念

第二节 紫外-可见分光光度计

第三节 紫外-可见分光光度分析方法

本章重点:紫外吸收光谱的特征;电子跃迁类型、吸收带类型及特点;Lambert-Beer 定律的物理意义、成立条件、影响因素及**相关计算**,百分吸光系数、摩尔吸光系数及吸收光谱;单组分定量方法和多组分等吸收双波长测定法。

第十二章 荧光分析法

第一节 基本原理

第二节 荧光定量分析方法

第三节 荧光分光光度计

本章重点: 荧光分析法的基本原理(分子荧光的产生、荧光的激发光谱和发射光谱、影响荧光强度的外部因素)。

第十三章 红外吸收光谱法

第一节 红外吸收光谱法的基本原理

第二节 有机化合物的典型光谱

第三节 红外光谱仪

本章重点: 红外吸收光谱法的基本原理(振动形式、红外吸收产生的条件、影响吸收峰位置的因素、特征区和指纹区、特征峰和相关峰)。

第十四章 原子吸收分光光度法

第一节 原子吸收分光光度法的基本原理

第二节 原子吸收分光光度计

第三节 实验方法

本章重点:原子吸收分光光度法的基本原理(线状光谱、共振线——特征谱线、轮廓和变宽);原子吸收分光光度计的主要部件;定量分析方法。

第十五章 核磁共振波谱法

第一节 核磁共振光谱的基本原理

第二节 核磁共振仪

第三节 化学位移

第四节 偶合常数

本章重点: 化学位移及其影响因素; 自旋偶合和自旋分裂规律。

第十六章 质谱法

第一节 质谱法的基本原理和质谱仪

第二节 质谱中的主要离子及其裂解类型

第三节 有机化合物的质谱解析

本章重点: 质谱法的基本原理: 分子离子峰的判断依据: 质谱仪主要部件及工作原理。

第十七章 色谱分析法概论

第一节 色谱法的分类

第二节 色谱过程和色谱流出曲线

第三节 色谱参数

第四节 色谱法的基本原理

第五节 色谱法的基本理论

第六节 色谱法的发展概况

本章重点:色谱过程和有关参数(色谱图、保留值、色谱区域宽度、分离度、分配系数、容量因子);基本原理:基本类型色谱方法及其分离机制;基本理论(塔板理论:理论塔板数、塔板高度、分离度概念及相关计算;速率理论:Van Deemter方程及其各项含义)。

第十八章 平面色谱法

第一节 平面色谱法的分类和有关参数

第二节 薄层色谱法

本章重点: 定性参数、相平衡的计算; 薄层色谱法的定性、定量分析方法。

第十九章 气相色谱法

第一节 气相色谱法的分类和气相色谱仪

第二节 气相色谱固定相和流动相

第三节 检测器

第四节 气相色谱速率理论和分离条件的选择

第五节 毛细管气相色谱法

第六节 定性与定量分析

本章重点:气液色谱固定液的分类及选择原则; FID、TCD、ECD 检测器的检测原理及其特点; 毛细管气相色谱法的特点和速率理论方程; 几种常用的定性、定量方法及适用范围; 气相色谱仪的一般流程和主要部件。

第二十章 高效液相色谱法

第一节 高效液相色谱法的主要类型

第二节 固定相和流动相

第三节 高效液相色谱速率理论和分离方法的选择

第四节 高效液相色谱仪

第五节 超高效液相色谱法简介

第六节 定性与定量分析方法

本章重点:反相键合相色谱法保留行为的主要影响因素和分离条件的选择;化学键合相的性质、特点、种类及使用注意事项;流动相对色谱分离的影响;HPLC的速率理论;定性、定量分析方法;高效液相色谱仪的一般流程和主要部件。

第二十一章 毛细管电泳法

第一节 毛细管电泳基础理论

第二节 毛细管电泳的主要分离模式

第三节 毛细管电泳仪

本章重点: 毛细管电泳法的基本原理和基本术语; 毛细管区带电泳法、胶束电动毛细管色谱法的分离机制。

第三部分 《药理学》

指定参考书:

杨宝峰,陈建国主编.《药理学》(供基础、临床、预防、口腔医学类专业用).人民卫生出版 社,第9版

乔国芬主编. 《药理学学习指导与习题集》. 人民卫生出版社,第 4 版 考试内容:

第二章 药物代谢动力学

药物代谢动力学(药动学)概念

解离型药物极性大,脂溶性小,难以扩散;而非解离型药物极性小,脂溶性大,易跨膜扩散。

第三章 药物效应动力学

药物效应动力学(药效学): 概念

药物的不良反应的名词解释

1、副作用: 2、毒性反应 3、后遗效应 4、停药反应 5、变态反应 6、特异性反应:

受体、激动药、拮抗药概念

第六章 胆碱受体激动药

- 一、M、N 胆碱受体激动药: 乙酰胆碱(ACH) 作用:
- 二、M 胆碱受体激动药: 毛果芸香碱

作用: 1、眼:表现为缩瞳、降低眼内压调节痉挛。 2、腺体:分泌增加尤以汗腺和唾液腺。 应用: 1、青光眼 2、缩瞳

第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药

- 一、易逆性胆碱酯酶抑制剂:新斯的明:口服吸收小而不规则,不表现中枢作用。
 - 应用: 1、重症肌无力 2、手术后腹气胀及尿潴留 3、阵发性室上性心动过速
 - 4、肌松药的解毒 另有:毒扁豆碱
- 二、难逆性胆碱酯酶抑制剂: 有机磷酸酯类

中毒症状: 1、M 样作用症状 2、N 样作用症状 3、中枢抑制系统症状

三、胆碱酯酶复活剂: 碘解磷定: 临用配制, 静注给药 氯磷定: 肌注或静注

第八、九章 胆碱受体阻断药

- 1、M 胆碱受体阻滞药: 平滑肌解痉药: 阿托品
- 2、N1 胆碱受体阻滞药:又称神经节阻断药,主用降血压,如美加明
- 3、N2 胆碱受体阻滞药: 骨骼肌松驰药,用于麻醉辅助剂,有琥珀胆碱、筒箭毒碱
- 一、M 胆碱受体阻滞药: 阿托品:

作用: 1、松驰内脏平滑肌 2、增加腺体分泌 3、眼:扩瞳、眼内压升高、调节麻痹

4、心血管系统: 低剂量心率减慢 5、中枢神经系统

应用: 1、解除平滑肌痉挛: 用于各种内脏绞痛 2、抑制腺体分泌: 全身麻醉前给药

- 2、眼科: 虹膜睫状体炎、眼底检查、验光
- 4、抗体克:感染中毒性休克

5、抗心率失常

6、解救有机磷酸酯类中毒

中毒症状:用镇静药或抗惊厥药对抗阿托品的中枢兴奋症状,用拟胆碱药毛果芸香碱或毒扁豆碱对抗"阿托品化"。

东莨菪碱:小剂量有明显镇静作用,大剂量有催眠作用。与苯海拉明用于晕船,晕车。呕吐。 山莨菪碱:有明显抗外周胆碱作用,能解除血管痉挛,降低血粘度。用于感染中毒性休克。

- 二、N1 胆碱受体阻滞药----神经节阻滞药: 美加明、咪噻吩: 主用作麻醉辅助药。
- 三、N2 胆碱受体阻滞药----骨骼肌松驰药: 本类药物的阻断作用可被胆碱酯酶抑制剂(新)拮抗。
 - 1、非去极化型肌松药:

筒箭毒碱:全麻辅药使肌肉松驰,中毒用新斯的明解救。大剂量血压下降,支气管痉挛。 泮库溴铵:作用是筒的5倍,不引起血压下降支气管痉挛。

2、去极化型肌松药:琥珀胆碱:口服不吸收,起效快,维持短。

第十章 肾上腺素受体激动药

第一节 α 受体激动药

一、α1、α2 受体激动药:

去甲肾上腺素: 化学性质不稳定, 见光易氧化, 在碱性中迅速氧化。口服无效。一般静滴。

作用: 1、血管: 除冠状动脉外, 几乎所有小动脉和小静脉均出现强烈收缩作用。

- 2、心脏: 使血压升高,心率减慢,心收缩力减弱。
- 3、血压: 收缩压及舒张压都升高。

应用: 1、休克: 忌用大剂量及长期应用。 2、上消化道出血。

不良反应: 1、局部组织坏死 2、局部肾功能衰退 3、停药后的血压下降。

间羟安: (阿拉明)替代 NA 用于各种休克早期。

二、α1受体激动药:

去氧肾上腺素:作用同 NA 可静滴肌注。防止脊椎麻醉或全身麻醉的低血压,快速短效扩瞳药。 三、 a 2 受体激动药:可乐定:用于降血压。

第二节 α,β受体激动药

肾上腺素:口服无效。一般皮下注射。

作用: 1、心血管系统: ①心脏: 激动心脏 β1 受体, 是一个强效的心脏兴奋药。

②血管: α缩血管, β2收血管。③血压: 升高

- 2、支气管平滑肌:扩张支气管,用于缓解支气管哮喘。
- 3、代谢:促进糖原及脂肪分解,使血糖升高。
- 4、中枢神经系统:不易透过血脑屏障。大剂量出现兴奋。

应用: 1、心脏停搏 2、过敏性休克 3、支气管哮喘 4、减少局部麻药吸收 5、局部止血 多巴胺: 作用: 1、心血管系统:激动心脏β1受体 2、肾脏:排钠利尿,激动α受体。

应用:用于抗休克,与利尿药合用治疗急性肾功能衰竭。

麻黄碱: 能激动α、β受体。

作用:

应用: 1、防止某些低血压状态。

- 1、加强心肌收缩力,增加心输出量。
 - 2、鼻粘膜充血肿胀引起的鼻塞。

2、松弛支气管平滑肌。

- 3、预防或缓解支气管哮喘发作
- 3、中枢神经系统:兴奋作用
- 4、缓解荨麻症等过敏反应的皮肤粘膜症状。

第三节 β 受体激动药

一、β受体激动药:

异丙肾上腺素----口服无效,舌下给药。作用于β1、β2受体,故能兴奋心脏,松弛平滑肌 及扩张骨骼肌血管。

作用: 1、心血管系统: 2、松弛支气管平滑肌 3、其他: 升高血糖。

应用: 1、支气管哮喘 2、房室传导阻滞 3、心脏骤停 4、休克

二、β1受体激动药: 多巴酚丁胺: 口服无效,用于心力衰竭。

四、β2受体激动药:沙丁胺醇:用于支气管哮喘。

第十一章 肾上腺素受体阻断药

第一节 α 受体阻滞药

一、α1、α2受体阻滞药: 酚妥拉明:口服生物利用度低。

作用: 1、心血管系统: 直接血管舒张作用,心收缩力加强,心率加快。 2、其他

应用: 1、治疗外周血管痉挛性疾病和血栓闭塞性及管炎。

- 2、局部浸润注射, 拮抗注射 NA 时药液外漏引起的血管强烈收缩。
- 3、抗休克 4、缓解高血压危象 5、用于充血性心力衰竭

三、α1受体阻滞药: 哌唑嗪: 抗高血压。

第二节 β 受体阻滞药

一、 β1、 β2 受体阻滞药: 普纳洛尔: 治疗心绞痛, 心率失常, 高血压, 甲状腺机能亢进。

第十四章 局部麻醉药

普鲁卡因:穿透力差,不用于表面麻醉。

丁卡因: 作用比普强 10 倍, 适用于表面麻醉。不宜用浸润麻醉。

利多卡因: 为普的2倍, 穿透力强, 作用快强。还用于治疗心率失常。都可用。

布比卡因:比利多卡因强 3-4 倍。用于浸润、传导、硬膜外麻醉。

第十五章 镇静催眠药

3、抗惊厥抗癫痫;

地西泮: 作用: 巴比妥类: 不良反应

1、抗焦虑; 1、眩晕困倦、精神运动不协调。

2、镇静催眠: 2、过敏感反应。

4、中枢肌肉松驰; 4、轻度抑制呼吸。

5、增加其他中枢抑制药的作用。 5、肝药酶诱导作用,加速自身和其他药物代谢。

苯巴比妥(长效)、戊巴比妥、异戊巴比妥(中效)、司可巴比妥(短效)、硫喷妥(超短效) (其他:水合氯醛,格鲁米特,溴化钠,溴化钾,三溴片)

3、依赖性。

第十六章 抗癫痫药和抗惊厥药

苯妥英钠: 钠通道阻滞药,减少钠内流,抑制高频放电的发生和扩散,对小发作无效。

作用: 1、抗癫痫 不良反应: 1、局部刺激

- 2、三叉神经痛
- 3、抗心律失常

- 2、神经系统
- 3、造血系统(巨幼红细胞贫血)
- 4、过敏反应

卡巴西平:对精神运动性发作最有效。

苯巴比妥:除对小发作无效外,其余都有效。抑制中枢,不作首选。静注控制癫痫持续状态。

扑米酮:对大发作和局限性发作优于苯巴比妥。对精神运动性发作不如卡马西平。

乙琥胺:治疗小发作的常用药。 丙戊酸钠:广谱扩癫痫药。

地西泮和劳拉西泮静脉注射是治疗癫痫持续状态的首选药。

第十七章 治疗中枢神经系统退行性疾病药

帕金森综合症是纹状体内多巴胺不足,乙酰胆碱功能相对亢进。机理为补充多巴胺或增强 多巴胺功能,亦可降低乙酰胆碱的作用。

第一节 拟多巴胺类药

一、左旋多巴:本身无药理活性,进入中枢脱羧成多巴胺后起治疗作用。

作用: 1、抗帕金森病; 2、心血管作用(直立性低血压); 3、内分泌作用(减少催乳素) 不良反应: 1、胃肠道反应 2、心血管反应(低血压)3、不自主异常动作 4、精神障碍。

禁与单胺氧化酶抑制剂,麻黄碱、利血平及拟肾上腺素药合用。维生素 B6 是多巴胺 脱羧酶辅基,可增强左旋多巴的外周副作用。

二、左旋氨基酸脱羧酶抑制剂:

卡比多巴:外周脱羧酶抑制剂。单独使用无药理作用,是左旋多巴的重要的辅助药。

苄丝肼:外周多巴脱羧酶抑制剂。苄丝肼与左旋多巴1:4配合成美多巴。

三、金刚烷胺:原是抗病毒药,有抗帕金森病作用。直接激动多巴胺受体及较弱的抗胆碱作用。四、麦角类多巴胺激动剂:溴隐亭、培高利特、氨基麦角林、麦角乙脲。

第二节 胆碱受体阻滞药

苯海索(安坦):对中枢纹状体的胆碱受体有明显的阻断作用。

其他有:卡马特灵、苯扎托品、比哌立登,普罗吩胺、二乙嗪。

第十八章 抗精神失常药

氯丙嗪:口服易吸收,有刺激深部肌注。

作用: 1、中枢神经系统: (1) 抗精神病作用; (2) 镇吐作用强; (3) 对体温调节的影响;

- (4)加强中枢抑制药的作用; (5)对锥体外系的影响。
- 2、植物神经系统: 一受体阻滞作用,使肾上腺素的升压作用翻转。M 胆碱受体阻滞。

3、内分泌系统:乳腺患者禁用。

不良反应: 1、中枢抑制症状: 嗜睡淡漠; M 受体阻滞症状口干便秘, 体位性低血压。

- 2、锥体外系反应: (1) 帕金森综合症; (2) 静坐不能; (3) 急性肌张力障碍。
- 3、过敏反应:
- 4、急性中毒:

米帕明:作用:1、中枢神经系统:正常人服用镇静,抑郁病人服用精神振奋,情绪提高。

- 2、植物神经系统: M 受体阻滞作用。
- 3、心血管系统:引起降压,心律失常,对心肌有奎尼丁样抑制作用。

抗抑郁药另有: 地昔帕明、阿米替林、多塞平、米安色林、诺米芬新、曲唑酮、马普替林。 抗躁狂症药: 碳酸锂

第十九章 镇痛药

第一节 阿片生物碱类镇痛药

吗啡:不作口服,常皮下注射。是一种阿片受体激动剂。

- 作用: 1、中枢神经系统: (1) 镇痛镇静 (2) 抑制呼吸 (3) 镇咳(4) 其他: 缩瞳呕吐
 - 2、血管扩张: 血压下降, 引起体位性低血压, 脑血管扩张, 颅内压升高。
 - 3、兴奋平滑肌:引起便秘、胆绞痛,阿托品可部分缓解。

应用: 1、镇痛 不良反应: 1、治疗量呕吐,便秘,颅内压升高体位性低血压。

- 2、心源性哮喘
- 2、耐受性和依赖性

3、止泻

3、中毒量:昏迷呼吸抑制,可用吗啡拮抗剂纳络酮。

第二节 人工合成镇痛药

一、阿片受体激动剂: 派替啶(度冷丁)

作用: 1、镇痛、镇静

应用: 1、镇痛

- 2、兴奋平滑肌(不引起便秘无止泻)
- 2、麻醉前给药及人工冬眠
- 3、血管扩张(扩张血管引起体位性低血压)
- 3、心源性哮喘和肺水肿

芬太尼:强效镇痛药,是吗啡的100倍。

安那度: 为一种短效镇痛药。

美沙酮:与吗啡相当,口服有效,是常用的吗啡和海洛因成瘾的代替药物。

二、阿片受体部分激动剂:

喷他左辛 (镇痛新): 不易产生依赖性,列入非麻醉药品。主要用于慢性剧痛。

丁丙诺啡: 镇痛较吗啡强,不良反应相似,是阿片类药物依赖脱毒治疗的重要代替药物。

第三节 非麻醉性镇痛药

四氢帕马丁: (延胡索乙索)

第四节 阿片受体拮抗剂

纳络酮:用于阿片类镇痛药中毒的解救药,可迅速解救呼吸抑制及其他中枢抑制症状。

纳曲酮:一次用药维持72小时,已用于解除阿片类的精神依赖性。

第二十章 解热镇痛抗炎药

作用机制是抑制环氧加酶,减少前列腺素 PG 的合成。

一、水杨酸类: 乙酰水杨酸(抗炎抗风湿)

不良反应:

作用: 1、解热镇痛抗炎抗风湿 1、胃肠道反应 4、水杨酸反应

2、影响血栓形成

2、凝血障碍(VK 对抗) 5、瑞夷综合症

3、过敏反应

- 二、苯胺类:对乙酰胺基酚(扑热息痛),抗炎抗风湿作用很弱,长期反复应用可致依赖性。
- 三、吡唑酮类:保泰松、羟基保泰松:抗炎抗风湿作用强,解热镇痛作用弱。主治风关节炎。

不良反应: 1、胃肠道反应 2、水钠潴留 3、过敏反应

四、其他抗炎有机酸类: 吲哚美辛(消炎痛)、布洛芬、萘普生、酮洛芬、氯芬那酸、双氯芬酸。 吡罗昔康: 强效、长效抗炎镇痛药。主要不良反应为胃肠道反应,不宜长期服用。

第二十二章 抗心律失常药

一、 I 类: 钠通道阻滞药

奎尼丁: 作用:

不良反应: 1、胃肠道反应

1、降低自律性

2、金鸡钠反应

2、减慢传导

3、低血压:静注急剧下降,不宜。

3、延长有效不应期(ERP)

4、血管栓塞

4、阻断α-受体和抗胆碱作用。

5、心动过缓或停搏

6、奎尼丁晕厥

7、过敏反应

用于室上性和室性过速型心律失常,一般用于其他药无效时才使用。

普鲁卜因胺: 广谱药。用于室上性和室性心律失常,用于奎尼丁不能耐受时,口服静注都可。

丙吡胺(灰舒平)、安他唑啉(安他心)、阿义马林(阿马林)、吡美诺

利多卡因: 首过效应, 静注。对急性心肌梗死引起的室性心律失常为首选, 室上性基本无效。

作用: 1、降低自律性 2、缩短 APD 相对延长 ERP 3、改变病变区传导速度

不良反应: 主要为中枢神经系统(CNS)的影响,静注过快过大引起低血压,心动过缓。

美西律:口服有效,急慢性室性心律失常。控制奎尼丁无效的室性心律失常。

妥卡因:口服完全吸收,用于各种室性心律失常,其他药无效时应用。

苯妥英钠: 用于强心苷中毒引起的室上性心律失常。 阿普林定(安搏律定)

普罗帕酮(心律平):口服可吸收,首过效应强生物利用度低。剂量个体化。室性室上性早搏。 恩卡尼、劳卡尼、氟卡尼

二、II类: β-受体阻滞药

普萘洛尔(心得安):用于室上性心律失常,对室性心律失常一般无效。不良反应较利、苯高。作用: 1、自律性 2、延长 ERP 3、传导性

三、III类:延长动作电位是程药

胺碘酮:口服吸收慢少,为广谱抗心律失常药。

溴苄胺: 仅用于一线抗心律失常药利多卡因、普鲁卡因不奏效的威胁生命的室性心律失常。四、IV类: 钙拮抗药

维拉帕米: 口服吸收快完全,首过效应明显。用于室上性心律失常,对消除由于 AV 折返或 房室交界区异常引起的阵发性室上性心动过速的急性发作已成首选,另有扩张血 管,降低血压。不良反应:心脏及胃肠道。

地尔硫 : 用于阵发性室上性心动过速,房扑或房颤。

第二十四章 利尿药

一、强效利尿药: 呋塞米(速尿): 作用:1、利尿作用 2、扩血管作用

临床应用: 1、严重水肿

不良反应: 1、水与电解质紊乱

2、急性肺水肿和脑水肿

2、胃肠道反应

3、预防急性肾功能衰竭

3、耳毒性

4、加速毒物排出

4、其他偶致皮疹骨髓抑制

二、中效利尿药: 氢氯噻嗪 作用: 1、利尿 2、降压作用 3、抗利尿作用

应用: 1、水肿: 是轻中度心性水肿的首选药。 2、降血压 3、尿崩症

不良反应: 1、电解质紊乱 2、高尿酸血症 3、升高血糖 4、过敏反应

三、弱效利尿药:

氨苯蝶啶、阿米洛利:作用于远曲小管远端和集合管,直接抑制选择性钠通道,减少钠的重吸收,抑制 K—Na 交换,使 Na 排出增加而利尿,同时伴血钾升高。

螺内酯(安体舒通): 竞争与醛固酮受体结合, 拮抗醛固酮的排钾保钠作用, 是保钾利尿药。

甘露醇: 渗透性利尿药、又称脱水药 另有: 山梨醇 、50 葡萄糖

作用: 1、组织脱水作用 2、增加肾血流量 3、渗透性利尿作用

应用: 1、预防急性肾功能衰竭 2、脑水肿及青光眼

第二十五章 抗高血压药

第一节 肾上腺素能神经阻断药

一、中枢性降压药

可乐定:口服吸收良好,作用强而快,短时间升压,长时间降压,心输出量及外周阻力降低。 甲基多巴:使外周阻力降低而降压,适于肾功能不全的高血压病人。 莫索尼定

- 二、神经节阻滞药:阻滞后使血管扩张,外周阻力降低,回心血量减少,血压下降。快强少用。
- 三、影响肾上腺素能神经末梢递质的药物

利舍平:缓慢、温和、持久。还有镇静安定作用。不良反应多,肌注静注用于高血压危象。 胍乙啶:扩张小静脉,静脉回流与心输出量减少,扩张小动脉,外周阻力降低。

四、肾上腺素受体阻滞药

哌唑嗪: 口服易吸收,首过效应明显。作用中等偏强,可选择性阻断α-受体,降低回心阻力及回心量。伴肾功能不良更适用。不良反应有首剂现象。 特拉唑嗪、多沙唑嗪普萘洛尔: (1) 阻滞心脏β--受体,使心收缩力减弱,心率减慢,心输出量降低。

- (2) 阻滞肾脏 β 一受体,减少肾素分泌,从而抑制肾素—血管紧张素—醛固酮降压。
 - (3) 可透过血脑屏障,阻滞中枢β--受体,外周交感神经降低,血管阻力降低。
 - (4) 阻滞突触前膜β--受体,减少NE释放。

很少发生体位性低血压,心衰、支气管哮喘病人禁用。

第二节 利尿降压药

氢氯噻嗪: 温和, 不易产生耐受性, 长期易致低血 K, 易补 K。

第三节 血管扩张药

分两类: 一种仅作用或主要作用于小动脉平滑肌; 另一种对动脉、静脉都有舒张作用。

硝普钠:降压作用强大,迅速而短暂,使动脉、静脉都扩张。不能口服,连续静滴给药。

主要用于高血压危象, 充血性心力衰竭, 急性心肌梗死。

第四节 钙拮抗药

硝苯地平、维拉帕米、硫氮 酮、尼卡地平、尼索地平。

第五节 影响肾素—血管紧张素系统的降压药

卡托普利: (血管紧张素转化酶抑制剂)降低外周血管阻力,轻中度原发性或肾型高血压首选药。 不良反应: 顽固性干咳,皮疹、味觉减退,少数出现蛋白尿。

氯沙坦: (血管紧张素Ⅱ受体拮抗药)为第一个临床应用口服有效的非肽类 ANG2 受体拮抗药。

第六节 其他抗高血压药

- 一、钾通道开放剂:二氮嗪、米诺地尔、吡那地尔、
- 二、5一羟色胺(5-HT)受体拮抗剂:酮色林、
- 三、前列环素合成促进剂: 西氯他宁

第二十六章 治疗心力衰竭的药物

一、 强心苷

强心苷: 洋地黄毒苷、地高辛、毛花苷 C。主用于治疗心衰及心房扑动或颤动。

机制:正性肌力作用主要是抑制细胞膜结合的 NA、K—ATP 酶,使细胞内 Ca 增加。

作用: 1、加强心肌收缩力,只增加 CHF 病人心搏出量,甚至减少心肌耗氧量。

- 2、减慢心率
- 3、对心肌电生理特性的影响: ①传导性, ②自律性, ③有效不应期
- 应用: 1、慢性心功能不全
 - 2、心律失常:禁用室性心动过速。

毒性反应: 1、胃肠道反应 2、神经系统反应 3、心脏毒性(出现各种类型心律失常) 苯妥英纳和利多卡因等抗心律失常药对强心苷引起的过速型心律失常非常有效。

二、非苷类正性肌力药

多巴胺(β-受体兴奋药): 使胞内 Ca 浓度增加,静滴迅速增强心肌收缩力。短期改善症状, 大剂量心率加快,心肌收缩力加强,诱发心律失常。

三、血管紧张素转化酶抑制剂

第二十七章 抗动脉粥样硬化药

- 一、调血脂药血脂包括: 胆固醇(CH)、三酰甘油(TG)、磷脂(PL)。
 - 1、MG—CoA 还原酶抑制剂(胆固醇生物合成的限速酶)目前应用有效的一类重要调血脂药。 洛伐他汀:为一种非活性的前药。使 VLDL 略下降,TG 水平下降,HDL—C升高。
 - 2、胆汁酸螯合剂: 考来烯胺: 对高胆固醇血症可作为首选药。考来替泊、降胆葡胺。
 - 3、苯氧芳酸类:

氯贝特:可降低血浆 VLDL 和 TG,升高 HDL,主用于以 TG 增高为主的高血脂症。

不良反应: 胃肠道反应。另有: 非诺贝特、苯扎贝特、吉非贝齐。

- 4、烟酸类:烟酸:广谱降脂药,不良反应较多。阿西莫司
- 二、抗氧化药: 普鲁布考(丙丁酚)、维生素 E 维生素 C

第二十八章 抗心绞痛药

分三类: (1) 劳类型心绞痛也称稳定型心绞痛 (2) 变异型心绞痛 (3) 不稳定型心绞痛 一、有机硝酸酯类: 硝酸甘油: 不易口服。

作用机制:主要扩张静脉,较小扩张小动脉作用,对血管平滑肌有舒张作用,几乎对所有平滑肌都有舒张作用。

作用: 主用于治疗和预防各种类型心绞痛,也用于充血性心力衰竭及急性心肌梗死的治疗。减轻心脏的前后负荷,减少心肌耗氧量。

不良反应: 常见头痛,体位性低血压,剂量过大血压过度降低。禁用低血压、青光眼。

二、β--受体阻滞药

普萘洛尔:心率减慢,心收缩力减弱,心输出量减少及动脉压降低,减轻心脏负担,降低 心肌耗氧量。用于预防稳定型心绞痛,对冠状动脉痉挛引起的变异型心绞痛不宜用。

三、钙拮抗药

硝苯地平:口服完全从肠胃道吸收,有肝首过效应。抑制血管平滑肌和心肌细胞 Ca 内流。 对小动脉平滑肌较静脉更敏感。外周血管阻力降低,血压下降,心肌耗氧量降 低,同时扩张冠状动脉,增加冠脉流量和心肌供氧量,无抗心律失常作用。

临床应用:用于预防心绞痛,特别适用于变异型心绞痛和冠状动脉痉挛所致心绞痛。

地尔硫 : 口服吸收良好,受肝首过效应,可扩张冠状动脉及外周血管,使心收缩力降低。 用于冠心病,心绞痛治疗,对轻中度高血压也有疗效,尤适老年人。

四、其他抗心绞痛药

尼可地尔、乙氧黄酮、卡波孟、芬地林、双嘧达莫、曲匹地尔、曲美他嗪、地拉齐普、苯磺达隆、桂哌酯、氯达香豆素、维司那定、奥昔非君、依他苯酮、加匹可明、伊莫拉明、更利芬、布他拉胺、海索苯定、银杏叶、冠心舒。

第二十九章 作用于血液及造血系统的药物

一、抗贫血药:常见贫血有缺铁性贫血,巨幼红细胞性贫血和再生障碍性贫血。 铁剂:硫酸亚铁、枸橼酸铁铵、右旋糖酐铁。用于各种原因引起的缺铁性贫血。 叶酸:作为补充疗法用于各种原因所致的巨幼红细胞性贫血,与 VB12 合用效果较好。 维生素 B12:用于治疗恶性贫血和其他巨幼红细胞贫血。

二、促凝血药和抗凝血药:

促凝血药:维生素 K 1、维生素 K 缺乏症; 2、抗凝药过量出血; 3、治疗胆道蛔虫所致胆绞痛。 抗纤维蛋白溶解药:氨甲苯酸、氨甲环酸

抗凝血药: 肝素: 口服无效,常静注给药。过量可致出血,用硫酸鱼精蛋白对抗。

用于: 1、防止血栓栓塞性疾病; 2、弥漫性血管内疾病; 3、其他体内外抗凝。 香豆素类抗凝剂: 双香豆素、醋硝香豆素、新双香豆素、华法林口服慢,体外无效。

枸橼酸钠:一般性体外抗凝血。注意引起低血钙。

三、纤维蛋白溶解药:对形成的血栓有溶解作用,亦称溶栓药。

链激酶、尿激酶: 用于急性血栓栓塞性疾病,不良反应为出血和过敏。

- 四、抗血小板药:预防血栓形成。前列环素、双嘧达莫(潘生丁)、噻氯匹定。
- 五、血容量扩充药:右旋糖酐

第三十章 组胺受体激动药和阻断药

- 一、组胺受体激动药: 倍他司丁(抗眩啶)
- 二、抗组胺药:
 - 1、H1 受体阻滞药:
 - (1) 抗组胺作用: 能完全对抗组胺收缩支气管、胃肠道及子宫平滑肌的作用, 也能部分对抗组胺引起的血管扩张和毛细血管通透性增加。
 - (2) 中枢作用: 中枢抑制作用 (3) 抗胆碱作用。

应用: (1) 变态反应性疾病 (2) 晕动病及呕吐 (3) 失眠

2、H2 受体阻滞药: 主用于治疗消化性溃疡。

西米替丁、雷尼替丁、法莫替丁、尼扎替丁

第三十三章 子宫平滑肌兴奋药和抑制药

一、缩宫素: 作用: 1、兴奋子宫 2、其他促进排乳 应用: 1、催产和引产 2、产后出血

- 二、麦角生物碱:作用:1、兴奋子宫 2、收缩血管 3、阻断 a 受体(翻转肾上腺素的升压) 应用:1、子宫出血 2、产后子宫复原 3、偏头痛
- 三、前列腺素:对子宫有显著兴奋作用,用于足月引产和诱发流产。

第三十五章 肾上腺皮质激素类药物

一、糖皮质激素类药:可的松、氢化可的松(短效); 泼尼松(强的松)、泼尼松龙、甲泼尼松、 曲安西龙(中效); 地塞米松、倍他米松(长效)

作用: 1、对代谢的影响 (1)促进糖原异生,升高血糖 (2)加速组织的蛋白质分解抑制蛋白

质的合成 (3)大剂量长期应用形成心向性肥胖 (4) 导致高血压和水肿

- 2、抗炎作用 3、免疫抑制作用 4、抗毒作用 5、抗休克 6、中枢作用
- 7、退热作用 8、对血液成分的影响
- 临床应用: 1、替代疗法 2、自身免疫性疾病 3、过敏性疾病 4、严重感染
 - 5、抗休克 6、血液病
- 不良反应: 1、肾上腺皮质功能亢进综合症 2、诱发和加重感染 3、消化系统并发症
 - 4、运动系统并发症
- 5、其他可致精神失常

停药反应: 1、药源性皮质功能不全 2、反跳现象

- 二、促皮质激素及皮质激素抑制药: 促皮质激素(ACTH); 米托坦、美替拉酮
- 四、盐皮质激素:醛固酮和去氧皮质酮:具明显潴钠排钾作用,用于慢性肾上腺皮质功能减退。

第三十六章 甲状腺激素及抗甲状腺药

一、甲状腺激素:甲状腺素、三碘甲状腺原氨酸

药理作用: 1、维持正常生长发育 2、促进代谢

临床应用: 1、呆小病 2、粘液性水肿 3、单纯性甲状腺肿

二、抗甲状腺药:甲硫氧嘧啶、丙硫氧嘧啶、甲硫咪唑(他巴唑)、卡比马唑(甲亢平) 应用:1、甲亢的内科治疗 2、甲状腺手术前准备 3、甲状腺危象的辅助治疗 碘:大量碘用于甲的手术前准备,甲状腺危象的治疗。

第三十七章 胰岛素及其他降血糖药

- 一、胰岛素:口服无效,皮下注射吸收快作用短。治疗胰岛素绝对或相对缺乏的各型糖尿病。 作用:1、对糖代谢:增加糖原合成和储存,抑制糖分解和异生。
 - 2、对脂肪代谢:促进脂肪合成并抑制其分解。
 - 3、对蛋白质代谢:促进蛋白质形成,抑制蛋白质分解。

不良反应: 1、低血糖反应 2、过敏反应 3、胰岛素耐受性

- 二、口服降血糖药:适用于轻中度
 - 1、磺酰脲类:甲苯磺丁脲、氯磺丙脲;格列本脲、格列吡嗪、格列齐特
 - 2、双胍类: 苯乙双胍(降糖灵)、二甲双胍(降糖片) 主用于肥胖及单用饮食控制无效者。

第三十九章 抗菌药物概论

第一节 常用术语

抗生素:指某些微生物在其生活过程中产生的具有抗病原体作用和其他活性的一类物质。 抗菌活性:指抗菌药物抑制或杀灭病原微生物的能力。 抑菌药: 仅有抑制微生物生长繁殖而无杀灭作用。磺胺类、四环素、氯霉素、红霉素、洁霉素 杀菌药: 不仅能抑制微生物生长繁殖而且能杀灭微生物。青霉素、头孢菌素、氨基糖苷类。

第二节 抗菌药物的主要作用机制

- 一、抑制细菌细胞壁合成:青霉素与头孢菌素类
- 二、抑制细胞膜功能:包括两性霉素 B、多粘菌素和制霉菌素等。
- 三、抑制或干扰细胞蛋白质合成: 氨基苷类、四环素类、大环内酯类和氯霉素类等。
- 四、抑制 DNA、RNA 的合成: 喹诺酮类、乙胺嘧啶和利福平、磺胺类及其增效剂等。

第三节 细菌的耐药性

耐药性:因药物与细菌多次反复接触后,细菌对该药的敏感性降低甚至消失,又称抗药性。 交叉耐药性:细菌对某种抗菌药产生耐药性后,若对未接触过的其他抗菌药也具有耐药性。 耐药性产生机制:

1、产生灭活酶 2、改变靶部位 3、增加代谢拮抗物 4、改变通透性 第四节 抗菌药物的合理选用

抗菌药滥用易产生毒性反应、过敏反应、二重感染、细菌产生耐药性。

- 一、抗菌药合理应用的基本原则:
 - 1、按照适应症选药:青霉素对链球菌(引起上呼吸道感染)和 G 杆菌敏感,宜选用,不能用青霉素者可用红霉素,链球菌不能用庆大霉素。
 - 2、按药动学特点制定给药方案和疗程:一般有效血药浓度大于最小抑菌或杀菌浓度,小于最小中毒量。氯霉素、磺胺、青霉素、氨苄青霉素透过血脑屏障,可用于中枢感染。氨基苷类、大环内酯类用于中枢以外的感染。青霉素、头孢菌素、氨基苷类在尿液中浓度高,用于尿路感染。
 - 3、针对患者的情况合理用药:新生儿禁用氯霉素,致灰婴综合症。
 - 4、其他 感冒、上呼吸道感染等病毒性疾病,发热原因不明者不宜用抗菌药。
- 二、抗菌药的联合应用:病因未明而又危及生命的严重感染,单一药物不能控制的严重感染,或和混合感染;单一抗菌药物不能有效控制的感染性心内膜炎或败血症;长期用药有可能产生耐受性者。
- 三、联合用药注意事项:两药联用产生四种可能:无关、相加、协同、拮抗。

抗菌药分四类: 1、繁殖期杀菌剂: β -- 内酰胺类 -- 、二合产生用增强作用 2、静止杀菌药: 氨基苷类、多粘菌素等。 -- 二、三增强或相加

3、速效抑菌药:四环素类、氯霉素类及大环内酯类抗生素。一、三拮抗 4、慢性抑菌药:磺胺类。 二、四可能无关

第四十章 β--内酰胺类抗生素

β--内酰胺类抗生素具有杀菌活性,临床适应广、疗效高、毒性低的优点。毒性最低最有效。

改造后: 1、作用时间延长 2、对酸性环境稳定,可以口服 3、对β--内酰胺酶稳定

4、对 G 菌和绿脓杆菌有效 5、对厌氧菌如脆弱杆菌有效

第一节 β--内酰胺类抗生素作用机制

抑制细胞粘肽合成酶, 阻断细胞细胞壁粘肽合成。

第二节 青霉素类

青霉素: 性质稳定, 作用较强。能干扰细胞壁肽聚糖的生物合成。与丙磺舒合用提高疗效。

对G有强大的杀菌作用,为G感染首选。主用球菌、G杆菌及螺旋体所致各种感染。

青霉素 V:不耐酶,抗菌活性不及青霉素,不易用于严重感染。

氨苄青霉素、阿莫西林:特点为广谱,对 G 细菌的抗菌作用不及青霉素,对 G 杆菌如流感、大肠杆菌、变性杆菌、沙门杆菌、草绿色链球菌作用较强,对克雷伯菌和绿脓杆菌无效。

应用: 尿路感染,呼吸道感染、肠道感染、脑膜炎、对重症 G 杆菌感染病因未明不宜用。

羧苄西林(静注)、替卡西林(肌注)、卡茚西林:对绿脓杆菌有效。磺苄西林:肌注。

哌拉西林: 低毒、抗菌广、强。对绿脓杆菌有较大抗菌作用。

第三节 头孢菌素类

亦称先锋霉素类:特点是抗菌谱广,对G菌敏感,对绿脓杆菌、厌氧菌不理想,过敏反应少, 对酸和酶较稳定。是杀菌剂。

作用:第一代:用于G细胞感染,常用头孢唑啉,用于轻中度呼吸道和尿路感染。

第二代: 肺炎、胆道感染、尿路感染和其他组织器官感染。头孢呋辛、头孢克洛。

第三代:对大肠杆菌、克雷伯氏肺炎为首选,对军团菌无效。

第四代:对 G 菌作用外,对 G 菌的作用增强,对酶稳定,半衰期延长,无肾毒性。

不良反应:过敏、皮疹、药热。

第四节 非典型β--内酰胺类

氨曲南:具有耐酶、对青霉素无交叉过敏。常作为氨基苷类替代品,与氨基苷类合用加强对绿脓杆菌和肠杆菌属的作用。

克拉维酸:不可逆的竞争型抑制剂。 奥格门汀、替门汀 舒巴坦:(青霉烷砜)

亚胺培南:对大多数 G 和 G 需氧和厌氧菌等均有效,对酶稳定。对青霉素和头孢菌素类间一般 无交叉耐药性,可作为后两者替代品。

第四十一章 大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素

一、大环内酯类搞生素

抗 G 菌,有红霉素、麦迪霉素、螺旋霉素、吉他霉素、麦利霉素,罗红霉素,阿齐霉素等。 为无色的弱碱性化合物,碱化尿液治疗尿道感染,不易透过血脑屏障、经胆汁排泄、毒性低。

红霉素:不耐酸,同服碳酸氯氢钠,食物与碱性阻碍药物吸收,经胆汁粪便排出。

作用:属抑菌药,与青霉素相似但略广,对 G 菌有强大抗菌作用,尤对耐青霉素的金葡菌有效。 机制:抑制敏感细菌蛋白质合成,发挥抑菌或杀菌作用。

应用:首选用于白喉带菌者、支原体肺炎、沙眼衣原体所致婴儿肺炎及结肠炎、弯曲杆菌所致 败血症或肠炎。是治疗军团菌最有效的首选药,对青霉素过敏者可选用。

麦迪霉素:与红霉素相似或稍弱,但对红霉素耐药菌有效。作为红替代品,毒性较红低。

乙酰螺旋霉素: 主用于葡萄球菌、链球菌、肺炎球菌引起的呼吸道和软组织感染。

罗红霉素、克拉霉素、阿齐霉素。

二、克林霉素

克林霉素:取代林可霉素而常用。口服,不能透过血脑屏障、肝代谢,尿排泄。

作用:对G菌无效。红霉素与克林霉素竞争结合部位,拮抗,不宜合用。对厌氧菌有广谱抗 菌作用,用于治疗腹腔内和盆腔混合感染及头颈和下呼吸道厌氧菌感染。万古霉素 三、多肽类抗生素 杆菌肽(供外用)、万古霉素(静注)。

第四十二章 氨基苷类抗生素

- 一、氨基苷类:对 G 菌表现为杀菌作用,主用于治疗 G 菌引起的感染,有庆大霉素、妥布霉素、 西梭霉素和半合成的丁胺卡那霉素、及目前少用的链霉素、新霉素、卡那霉素。
 - 口服难吸收,可用于胃肠道消毒。肌内注射吸收完全。绿脓杆菌只对妥布霉素、庆大霉素、 阿米卡星敏感,链霉素主用于鼠疫杆菌和结核杆菌。

不良反应: 耳毒性、肾毒性、神经肌肉阻断作用和过敏反应,链霉素的过敏反应仅次于青霉素。

二、常用氨基苷类抗生素

链霉素:口服难吸收,对结核杆菌和鼠疫杆菌有强大的杀菌作用。对 G 杆菌和厌氧菌无效。应用:主要用于鼠疫与兔热引起的心内膜炎。与青霉素、氨苄西林合用治疗细菌性心内膜炎。不良反应:1、第八对脑神经损害。2、肾脏损害3、神经肌肉阻滞作用4、过过敏反应庆大霉素:肌注或静注,道选用于 G 如变形杆菌、产气杆菌、肺炎杆菌、大肠杆菌等。

不良反应: 第八对脑神经损害,肾毒性最大。不易与利尿酸及呋喃苯胺酸等利尿药合用。

丁胺卡那霉素: 使用最多的新氨基苷类抗生素。对许多 G 菌和绿脓杆菌产生的酶稳定。主用 于对其他氨基苷类耐药菌株引起的尿路、呼吸道及肺部感染、绿脓杆菌、变形 杆菌引起的败血症。

妥布霉素: 对绿脓杆菌作用较庆强 2-4 倍, 对庆耐药者仍有效, 主用绿脓杆菌及其他 G 菌。 三、多粘菌类:对 G 杆菌尤绿脓杆菌有强大的抗菌作用,对 G 和 G 球菌均无抗菌作用。对静止 期和繁殖期的阳性杆菌都有效,主用于对其他抗生素耐药难于控制的绿脓杆菌感染。

第四十三章 四环素类和氯霉素类

四环素、土霉素主要是抑制细菌的生长繁殖,高浓度也具有杀菌作用。但对绿脓杆菌、病毒和 真菌无效。抑制蛋白质合成。首选于肺炎支原体引起的原发性非典型肺炎的治疗。 土霉素: 用于肠道感染, 菌痢和阿米巴菌疾疗效好。

不良反应: 1、胃肠道反应

2、二重感染

3、对骨牙生长的影响

4、肝脏损害

5、维生素缺乏

多西环素: (强力霉素)为四环素的5倍,土霉素的50倍。

米诺环素: 高效、长效、速效的新合成四环素。

氯霉素: 药用为左旋体,右旋体无效。酸性中稳定。是广谱抑菌抗生素,伤寒首选。

临床应用:治疗伤寒副伤寒。治疗嗜血流感杆菌引起的脑膜炎。

不良反应: 1、骨骼抑制,不可逆的再生障碍性贫血 2、灰婴综合症

3、治疗性休克

4、二重感染

第四十四章 人工合成抗菌药

一、喹诺酮类:洛氟沙星、氧氟沙星、环丙沙星等八种常用。抗菌谱广、高效、口服、不良反 应少。对绿脓杆菌、厌氧杆菌有强大抗菌作用。主要是干扰 DNA 复制而起到杀 菌作用。

应用:用于敏感菌原菌所致的呼吸道感染、尿路感染、前列腺炎、淋病、胃关节软组织感染。 诺氟沙星:对淋球菌敏感,对绿脓杆菌作用强。主用于泌尿道和胃肠道感染。

二、磺胺类药:药动学:小肠上段吸收,通过血脑屏障,分布到脑脊液中,治疗流行性脑脊髓 膜炎首选。对螺旋体、支原体、病毒感染无效。对立克次体反能刺激生长。

应用: 1、流行性脑脊髓膜炎

2、呼吸道感染 3、泌尿道感染

4、伤寒

5、鼠疫

6、肠道感染

7、局部软组织或创面感染

不良反应: 1、泌尿系统的损害,应同服碳酸氢钠碱化尿液。 2、过敏反应

3、造血系统反应,可能抑制骨髓,检查血常规。 4、其他新生儿黄疸等

磺胺嘧啶: (SD) 治疗脑脊髓膜炎的首选药,亦用于尿路感染,注意对肾脏损害。

磺胺异 唑: (SIZ)尿中浓度高用于治疗尿路感染。

磺胺甲 唑: (SMZ,新诺明)适用于治疗尿路感染,注意碱化尿液。

三、抗菌增效剂:

甲氧苄啶(TMP): 抑制二氢叶酸还原酶, 使它不能还原成四氢叶酸, 从而阻止细菌核酸合成。 TMP 与 SMZ 或 SD 合用成复方新诺明或双嘧啶片。不良反应少, 少数人引起胃肠道反应。 四、硝基呋喃类药: 合成抗菌药。主用于泌尿道及外用消毒。

呋喃妥因: 久用可引起不可逆性耳神经损害。

呋喃唑酮: 痢特灵, 其栓剂可治疗阴道滴虫病。 呋喃西林

第四十五章 抗病毒药和抗真菌药

常用有灰黄霉素、制霉菌素、酮康唑、或局部应用的克霉唑和咪康唑等。

两性霉素 B(国产称庐山霉素): 必须静脉滴注,系广谱抗真菌药。首选治疗全身性深部感染。

不良反应:静注开始有寒战、高烧、头痛、恶心呕吐。肾脏毒性为本品的主要中毒反应。制霉菌素: 多用于长期使用抗生素所引起的真菌性二重感染。

灰黄霉素: 为一种抗浅表真菌药。

作用:对各种皮肤癣菌有强大的抑制作用。主用于治疗各种癣病如体癣、股癣、甲癣等, 尤对头癣疗效显著为首选。

克霉唑:对浅真菌与灰黄霉素相似,但头癣无效,仅局部用于体手足癣等。

咪康唑: 对深部真菌和部分浅表真菌具有良好抗菌作用,口服吸收差。

酮康唑:口服广谱真菌药。对念珠菌和浅表癣菌有强大的抗菌力。主要口服治疗多种浅表真菌。

氟康唑:与酮康唑相似,体外不及酮,体内则比酮强10-20倍,治疗中枢神经和尿路感染。

氟胞嘧啶: 抗深部真菌药。伊曲康唑: 相似于酮康唑, 但作用强。

第四十六章 抗结核病及抗麻风病药

分一线药:疗效高,不良反应小,如异烟肼、利福平、己胺丁醇、吡嗪酰胺、链霉素。

二线药:疗效差,毒性大,价格贵,不作常规。如氨基水杨酸、丙硫异烟胺、卡那霉素。

一、常用抗结核病药:

异烟肼: 易溶水, 性质稳定, 疗效高、毒性小、服用方便。口服吸收好。

作用:对结核杆菌有高度选择性,可联合用药,对其他抗结核药无交叉耐药性。首选药。 不良反应:小。癫痫、嗜酒、精神病史者慎用。用服维生素 B6 可预防。大剂量损害肝脏。 利福平: 高效低毒、口服方便。有强大的抑制或杀灭结核杆菌作用。仅次异烟肼。

不良反应: 胃肠首反应, 少数病人可见肝脏损害。

利福定:效力为利福平的3倍以上,有交叉耐药性。有胃肠道反应,肾功能不良慎用。

利福喷丁: 为利福增的 2-10 倍, 与利有交叉耐药性。

乙胺丁醇:右旋体有强大作用,左旋体无效。对链、异有耐药的结核杆菌仍有效,单用易耐药,三药合用用于重症的初治或复发性肺结核及空洞型肺结核的治疗。

链霉素: 作用仅次于异、利,仅呈抑菌效果。

对氨水杨酸:与异烟肼合用,可竞争肝脏的乙酰化酶,使后者游离浓度增高,产生协同作用。 卡那霉素:耐药产生慢,损害第八对脑神经和肾脏损害严重。检查听力和肾脏。

乙硫异烟胺、吡嗪酰胺

- 二、抗结核病药应用原则: 1、早期用药 2、联合用药 3、长期用药 4、短期疗法
- 三、抗麻风病药:

氯苯砜:口服吸收,用量少,疗效确切,体格低廉、服用方便。 氯苯酚嗪

第四十七章 抗寄生虫药

分间日疟虫、三日原虫、恶性疟原虫。

一、主要用于控制症状的抗疟药:

氯喹:口服肠道吸收,长效。道选用于控制临床症状,具有速效,强效,长效的红内期繁殖体杀菌剂。还有杀灭肠外阿米巴原虫以及免疫抑制作用。

应用: 1、治疗疟疾 2、治疗肠外阿米巴病 3、治疗自身免疫性疾病。

青蒿素: 其对耐氯喹早株感染有效,为世界卫生组织所推荐。高效,速效,低毒。对凶险的脑疟疾有良好的抢救作用。缺点是复发率高。

奎宁:最古老的抗疟药,尤其严重的脑型疟。另有哌喹、蒿甲醚、甲氟喹、咯萘啶本芴醇

- 二、主要用于病因性预防的抗疟药:乙胺嘧啶:是目前用于病因性预防的首选药。
- 三、主要控制复发和传播的药物:伯氨喹:治疗良性疟和阻断各型疟疾的传播。
- 四、抗疟疾的合理应用:

急性发作期:用氯喹、奎宁、哌喹、青蒿素等作用于红内期的药。

凶险性疟疾: 选用二盐酸奎宁、磷酸咯萘啶缓慢静滴或用青蒿素油剂肌内注射。

耐氯喹恶性疟: 选用奎宁、青蒿素。

临床性预防:选用乙胺嘧啶、TMP等。

防止复发和传播: 宜用伯氨喹。