

药理学笔记：药效学 - 药物作用机制 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/19/2021_2022__E8_8D_AF_E7_90_86_E5_AD_A6_E7_c23_19058.htm 药物效应多种多样，是

不同药物分子与机体不同靶细胞间相互作用的结果。药物作用的性质首先取决于药物的化学结构，包括基本骨架、活性基团、侧链长短及立体构形等因素。这些构效关系是药物化学研究的主要问题，但它有助于加强医生对药物作用的理解。药理效应是机体细胞原有功能水平的改变，从药理学角度来说，药物作用机制要从细胞功能方面去探索。

一、非特异性药物作用机制: 与药物的理化性质有关。1、渗透压作用：如甘露醇的脱水作用。来源：www.examda.com 2、脂溶作用：如全身麻醉药对中枢神经系统的麻醉作用。来源

：www.examda.com 3、膜稳定作用：阻止动作电位的产生及传导，如局部麻醉药，某些抗心律失常药等。4、影响PH：如抗酸药中和胃酸。来源：www.examda.com 5、络合作用：如二巯基丙醇络合汞、砷等重金属离子而解毒。

二、特异性药物作用机制: (与药物的化学结构有关) 1、干扰或参与代谢过程：

对酶的影响，多数药物能抑制酶的活性，如新斯的明竞争性抑制胆碱酯酶，奥美拉唑不可逆性抑制胃粘膜H-K ATP酶（抑制胃酸分泌），而有些药本身就是酶，如胃蛋白酶。参与或干扰细胞代谢，伪品掺入也称抗代谢药，

如5-氟尿嘧啶结构与尿嘧啶相似，掺入癌细胞DNA及RNA中干扰蛋白合成而发挥抗癌作用。影响核酸代谢，许多抗癌药是通过干扰癌细胞DNA或RNA代谢过程而发挥疗效的。

许多抗生素（包括喹诺酮类）也是作用于细菌核酸代谢而发挥

抑菌或杀菌效应的。来源：www.examda.com

2、影响生物膜的功能：如作用于细胞膜的离子通道的抗心律失常药通过影响Na、Ca²⁺或K的跨膜转运而发挥作用。

3、影响体内活性物质：乙酰水杨酸通过抑制前列腺素合成而发挥解热、镇痛和抗炎作用。

4、影响递质释放或激素分泌：如麻黄碱促进末梢释放去甲肾上腺素(NA)。

5、影响生理物质转运 在体内主动转运需要载体参与，干扰这一环节可药理效应。如利尿药抑制肾小管Na-K、Na-H交换而发挥排钠利尿作用。来源：www.examda.com

6、影响免疫机制 除免疫血清及疫苗外，免疫增强药及免疫抑制药通过影响免疫机制发挥疗效。

5、影响受体功能：掌握受体的概念和特征。熟悉受体激动药、拮抗药、竞争性拮抗药和非竞争性拮抗药的概念。了解受体的类型及药物与受体相互作用的信号转导。

(1)受体概念：受体为糖蛋白或脂蛋白，存在于细胞膜、细胞浆或细胞核内，能识别周围环境中某种微量化学物质，与药物相结合并能传递信息和引起效应的细胞成分。配体：能与受体特异性结合的物质。受体仅是一个“感觉器”，对相应配体有极高的识别能力。受体-配体是生命活动中的一种偶合，受体都有其内源性配体，如神经递质、激素、自身活性物等。来源：www.examda.com

(2)药物与受体结合作用的特点： 特异性与结构专一性；来源：www.examda.com 饱和性与立体选择性； 可逆性与内源性配体； 识别力与高度敏感性。

(3)激动药与拮抗药 激动药：能激活受体的配体，与受体有较强的亲和力和较强的内在活性(效应力)。 部分激动药：与受体有较强的亲和力和较弱的内在活性。部分激动药具有激动药与拮抗药两重特性。 拮抗药：能阻断其活性的配体

，与受体有较强的亲和力，但无内在活性。竞争性拮抗药：能与激动药互相竞争与受体可逆结合。非竞争性拮抗药：能与激动药互相竞争与受体不可逆结合。(4)受体调节与药物作用关系：受体可经常代谢转换处于动态平衡状态，其数量，亲和力及效应力受生理及药理因素的影响。来源

：www.examda.com 耐受性、不应性、快速耐受性：连续用药后药效递减是常见的现象。由于受体原因而产生的耐受性称为受体脱敏。受体向下调节：在激动药浓度过高或长期激动受体时，受体数目减少。与耐受性有关。受体向上调节：激动药浓度低于正常时，受体数目增加。与长期应用拮抗剂后敏感性增加有关，如突然停药时会出现反跳反应。

100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com