

第五十章 第一节 免疫抑制药药师资格考试 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/583/2021\\_2022\\_\\_E7\\_AC\\_AC](https://www.100test.com/kao_ti2020/583/2021_2022__E7_AC_AC)

[\\_E4\\_BA\\_94\\_E5\\_8D\\_81\\_E7\\_c23\\_583212.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/583/2021_2022__E7_AC_AC_E4_BA_94_E5_8D_81_E7_c23_583212.htm) 免疫系统包括参与免疫反应的各种细胞、组织和器官，如胸腺、淋巴结、脾、扁桃体以及分布在全身体液和组织中的淋巴细胞和浆细胞。这些组分及其正常功能是机体免疫功能的基本保证，任何一方面的缺陷都将导致免疫功能障碍，丧失抵抗感染能力或形成免疫性疾病。机体免疫系统在抗原刺激下所发生的一系列变化称为免疫反应，可分为以下三期（图50-1）：图50 - 1 免疫反应的基本过程和药物作用环节T细胞主要有两个亚群

；TH:辅助性T细胞（Helper T cell）能促进B细胞增殖分化；Ts抑制性T细胞（Suppressor T cell）能抑制B细胞分化

- 1.感应期 为处理和识别抗原的阶段；先由巨噬细胞吞噬和处理，在胞浆内降解、消化之，暴露出活性部位而与巨噬细胞mRNA结合形成复合体，使T、B细胞得以识别。
- 2.增殖分化期 抗原-mRNA复合体能刺激B或T细胞，使其转化为免疫母细胞并进行增殖。B细胞增殖分化为浆细胞，可合成多种免疫球蛋白IgG、IgM、IgA、IgD、IgE等抗体。T细胞增殖分化为致敏小淋巴细胞，分别对相应抗原起特异作用。
- 3.效应期 致敏小淋巴细胞或抗体再次与抗原相反应，产生细胞免疫或体液免疫效应。致敏小淋巴细胞再受抗原刺激时，可有直接杀伤作用或释放淋巴毒素、炎症因子等免疫活性物质，使抗原所在细胞破坏或发生异体器官移植的排异反应等。这称为细胞免疫。抗原与抗体结合，直接或在补体协同下破坏抗原的过程称为体液免疫。不论细胞免疫或体液免疫，其最终效果

都是消除抗原，保护机体。在调节免疫和炎症方面，淋巴因子（lymphokine）或单核因子（monokines）等细胞调节蛋白也起到重要的作用。它们可以由淋巴细胞、单核细胞及巨噬细胞产生，如干扰素、白细胞介素、肿瘤坏死因子、克隆刺激因子、巨噬细胞激活和抑制因子等，其中已有多种作用免疫调节剂应用。影响免疫功能的药物有两类：免疫抑制药（immunosuppressive drugs）能抑制免疫活性过强者的免疫反应；免疫增强药（immunopotentiating drugs）能扶持免疫功能低下者的免疫功能。

### 第一节 免疫抑制药

临床常用的免疫抑制药有环孢素、肾上腺皮质激素类、烷化剂和抗代谢药等。免疫抑制药都缺乏选择性和特异性，对正常和异常的免疫反应均呈抑制作用。故长期应用后，除了各药的特有毒性外，尚易出现降低机体抵抗力而诱发感染、肿瘤发生率增加及影响生殖系统功能等不良反应。

#### 环孢素

环孢素（cyclosporin，cyclosporin A）是霉菌 *Tolypocladium inflatum* 生成的一种脂溶性环状十一肽化合物。它可选择地作用于T淋巴细胞活化初期。辅助性T细胞被活化后可生成增殖因子白细胞介素2（interleukin 2，IL-2），环孢素可抑制其生成；但它对抑制性T细胞无影响。它的另一个重要作用是抑制淋巴细胞生成干扰素。它对网状内皮系统吞噬细胞无影响。因而环孢素不同于细胞毒类药物的作用，它仅抑制T细胞介导的细胞免疫而不致显著影响机体的一般防御能力。口服环孢素可被吸收，但不完全，其生物利用度仅20%~50%。口服后2~4小时血浆浓度达峰值。有40%的药物存在于血浆，50%在红细胞，10%在白细胞。在血浆中与蛋白的结合率为95%。它在体内几乎全部被代谢，从尿中排出的原形物不足服用量的0.1%。其 $t_{1/2}$ 约16小

时。环孢素在临床上主要用于防止异体器官或骨髓移植时排异等不利的免疫反应，常和糖皮质激素合用。在治疗自体免疫性疾病方面的临床应用尚在探索中。其毒性反应主要在肝与肾，在应用过程中宜监测肝、肾功能。肾上腺皮质激素类常用的有泼尼松、泼尼松龙、地塞米松等。它们对免疫反应的许多环节均有影响。主要是抑制巨噬细胞对抗原的吞噬和处理；也阻碍淋巴细胞DNA合成和有丝分裂，破坏淋巴细胞，使外周淋巴细胞数明显减少，并损伤浆细胞，从而抑制细胞免疫反应和体液免疫反应，缓解变态反应对人体的损害。烷化剂常用的有环磷酰胺、白消安、噻替派等。它们能选择性地抑制B淋巴细胞，大剂量也能抑制T淋巴细胞。还可抑制免疫母细胞，从而阻断体液免疫和细胞免疫反应。环磷酰胺作用明显，副作用较小，且可口服，故常用。抗代谢药类常用6-巯嘌呤与硫唑嘌呤。它们主要抑制DNA、RNA和蛋白质合成。硫唑嘌呤的毒性较小，故较常用。本类药物对T细胞的抑制较明显，并可抑制两类母细胞，故兼能抑制细胞免疫和体液免疫反应，但不抑制巨噬细胞的吞噬功能。用于肾移植的排异反应和自体免疫性疾病如类风湿性关节炎和全身性红斑狼疮等。抗淋巴细胞球蛋白

（antilymphocyte globulin，ALG）是直接抗淋巴细胞的抗体，现已能用单克隆抗体技术生产，特异性高，安全性好。它可与淋巴细胞结合，在补体的共同作用下，使淋巴细胞裂解。可用于器官移植的排斥反应，多在其他免疫抑制药无效时应用。更多信息请访问：[执业药师网校](#) [百考试题论坛](#) [百考试题在线考试系统](#) [百考试题执业药师加入收藏](#) 特别推荐：2009年药师资格考试报名时间汇总"#F8F8F8" 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](http://www.100test.com)