

# 神经精神药理学

NEUROPSYCHO-  
PHARMACOLOGY

库宝善 主编



北京大学医学出版社

# 神经精神药理学

主 编 库宝善  
编 委 (按姓氏笔画为序)  
于龙川 王向群 李 锦  
库宝善 张开镐 梁建辉

北京大学医学出版社

# SHENJING JINGSHEN YAOLIXUE

## 图书在版编目(CIP)数据

神经精神药理学 / 库宝善主编. —北京: 北京大学  
医学出版社, 2006. 8

ISBN 7-81071-854-1

I. 神… II. 库… III. 精神药理学 IV. R964

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2005) 第 077769 号

## 神经精神药理学

---

主 编: 库宝善

出版发行: 北京大学医学出版社 (电话: 010-82802230)

地 址: (100083) 北京市海淀区学院路 38 号 北京大学医学部院内

网 址: <http://www.pumpress.com.cn>

E-mail: [booksale@bjmu.edu.cn](mailto:booksale@bjmu.edu.cn)

印 刷: 北京圣彩虹制版印刷技术有限公司

经 销: 新华书店

责任编辑: 张彩虹 责任校对: 杜 悦 责任印制: 郭桂兰

开 本: 787mm × 1092mm 1/16 印张: 35.5 字数: 907 千字

版 次: 2006 年 8 月第 1 版 2006 年 8 月第 1 次印刷 印数: 1-3000 册

书 号: ISBN 7-81071-854-1/R-854

定 价: 115.00 元

版权所有, 违者必究

(凡属质量问题请与本社发行部联系退换)

本书由

北京大学医学部科学出版基金

资助出版

# 作者名单

**主 编** 库宝善

**编 委** (按姓氏笔画为序)

于龙川 王向群 李 锦 库宝善 张开镐 梁建辉

**编 者** (以章节先后为序)

库宝善 (北京大学医学部基础医学院)

于恩华 (北京大学医学部基础医学院)

雷季良 (北京大学医学部基础医学院)

于龙川 (北京大学生命科学学院)

殷 明 (上海交通大学药学院)

李云峰 (军事医学科学院毒物药物研究所)

张永鹤 (北京大学医学部基础医学院)

苏瑞斌 (军事医学科学院毒物药物研究所)

陈 忠 (浙江大学医学院药理室)

李 锦 (军事医学科学院毒物药物研究所)

马传庚 (安徽医科大学药理教研室)

岳 旺 (青岛大学医学院药理室)

梁建辉 (北京大学中国药物依赖性研究所)

王向群 (北京大学精神卫生研究所)

张开镐 (北京大学中国药物依赖性研究所)

李卫东 (北京大学医学部基础医学院)

郑荣远 (温州医学院附属第一医院)

戴体俊 (徐州医学院麻醉药理学教研室)

石京山 (遵义医学院药理室)

蒋袁絮 (宁夏医学院药理教研室)

潘建春 (温州医学院药学院)

刘善庭 (济宁医学院药理室)

谭焕然 (北京大学医学部基础医学院)

王小同 (温州医学院附属第二医院)

**协编者** (以章节先后为序)

崔翔宇 陈宝琼 吴 宁 范 丽 周兰兰 夏念信 韩 容 刘飞虎 石玲燕

李 梅 褚青平 龚其海 罗 璨 陈 瑶 蒋文高 张风云 赵 鑫 张有志

李俊旭 马 行 徐 英 辛 勤 孙艳萍 邵胜敏 陈松芳 殷为勇 顿念念

**主编秘书** 张风云 姚海燕

# 前 言

神经科学发展日新月异,神经精神药理学显得越来越重要。为此,邀请国内20多位知名专家,发挥各自专长,精心编写了本书。本书内容面向基础和临床,可作为医疗、教学和科研工作者的参考书。本书有如下五大特点:

1. 简明扼要的神经解剖和神经生理学概念,中英文对照的名词解释。
2. 神经科学相关的活性物质如神经递质、神经调质和自由基等的最新进展。
3. 比较详尽的神经科和精神科常用药物的药理学知识。
4. 各类疾病和治疗药物研究中,最常用的药理学实验方法和相关术语。
5. 大量中、英文名称综合征的精炼解释,排除了读者难于查找的烦恼。

全书格式相对统一,但又保留一定的特点,以便充分发挥各领域专家的潜能。

本书主要参考书:

- (1) Martindale the Extra Pharmacopoeia. 32th ed, 1999
- (2) Goodman & Gilman's the Pharmacological Basis of Therapeutics. 10th ed, 2001
- (3) Katzung BG. Basic and Clinic Pharmacology, 2001
- (4) 徐叔云. 中华临床药理学. 人民卫生出版社, 2003
- (5) 杨藻宸. 药理学和临床治疗学. 人民卫生出版社, 2000
- (6) 库宝善. 药理学. 北京大学医学出版社, 2004

书中如果引用上述著作文献,则直接在右上角标出是哪一本书的哪一页,如属于常用药物亦可不标出。

本书得以顺利出版,首先感谢各位作者的积极参与、中国药理学会神经药理学专业委员会的重视、北京大学医学部科学出版基金的及时资助。还要感谢北京大学医学部基础医学院药理学系老师们的全力协助。

对于本书不当之处或有新的建议,万望各位读者不吝赐教。

库宝善

# 目 录

## I 基本概念 Basic Concepts

1	药理学的基本原理 Principles of Pharmacology .....	3
1.1	药理学的定义及任务 Definition and role of pharmacology .....	3
1.2	药物的处置 Drug disposition .....	3
1.3	药物代谢动力学 Pharmacokinetics .....	7
1.4	药效学 Pharmacodynamics .....	9
2	神经元和胶质细胞 Neuron and Glial Cell .....	15
2.1	神经元 Neuron .....	15
2.2	胶质细胞 Glial cell .....	18
3	中枢神经系统解剖 Central Nervous System Anatomy .....	21
3.1	脊髓 Spinal cord .....	21
3.2	脑干 Brain stem .....	23
3.3	小脑 Cerebellum .....	30
3.4	间脑 Diencephalon .....	31
3.5	端脑 Telencephalon .....	33
3.6	传导通路 Pathway .....	38
4	神经生理学机制 The Mechanisms of Neurophysiology .....	45
4.1	神经细胞的结构与功能 Structure and functions of nerve cells .....	45
4.2	神经细胞的兴奋性和膜电位 The neuronal excitability and membrane potential .....	48
4.3	细胞膜的离子通道 The ion channels of cellular membrane .....	50
4.4	神经细胞的受体 The neuronal receptors .....	52
5	突触与跨膜信号转导 Synapse and Transmembrane Signal Transduction .....	58
5.1	信号在突触部位的转导 Signal transduction at synapse .....	58
5.2	跨膜信号转导的过程与调节 The process and modulation of transmembrane signal transduction .....	61
5.3	跨膜信号转导对基因表达的调控 Modulation of transmembrane signal transduction on the gene expression .....	66

## II 神经递质和神经调质 Neurotransmitters and Neuomodulators

6	乙酰胆碱 Acetylcholine .....	75
6.1	功能解剖学 Functional anatomy .....	75
6.2	乙酰胆碱的化学 The chemistry of acetylcholine .....	76
6.3	乙酰胆碱的生物合成 Biosynthesis of acetylcholine .....	77
6.4	乙酰胆碱的摄取、储藏和释放 The intake, storage and release of acetylcholine .....	79
6.5	乙酰胆碱的灭活 Inactivation of acetylcholine .....	81
6.6	胆碱受体 Cholinergic receptor .....	82
7	儿茶酚胺 Catecholamines .....	86
7.1	儿茶酚胺的一般特征 General characters of catecholamines .....	86
7.2	儿茶酚胺受体及其信号转导 Receptors and signal transduction of catecholamines .....	88
7.3	儿茶酚胺的生理功能 Physiological functions of catecholamines .....	91
7.4	儿茶酚胺的药理学作用 Pharmacological functions of catecholamines .....	92
8	5-羟色胺 5-Hydroxytryptamine .....	95
8.1	5-羟色胺神经通路 The pathway of serotonergic neurons .....	95
8.2	5-羟色胺生物合成和代谢 The biosynthesis and metabolism of serotonin .....	96
8.3	5-羟色胺受体的分类、分布及其功能 The classification, distribution and function of 5-HT receptors .....	98
8.4	5-羟色胺及其受体与疾病的关系 The relationship between 5-HT, 5-HT receptors and diseases .....	105
9	氨基酸类神经递质 Amino Acid Neurotransmitters .....	112
9.1	兴奋性氨基酸 Excitatory amino acids .....	112
9.2	抑制性氨基酸 Inhibitory amino acids .....	116
10	组胺 Histamine .....	121
10.1	组胺的储存、合成与消除 The storage, synthesis and degradation of histamine .....	121
10.2	组胺神经元的分布 Distribution of histamine neurons .....	122
10.3	组胺受体 Receptor of histamine .....	124
10.4	组胺与中枢神经系统疾病 Histamine and CNS diseases .....	129
11	肽类神经递质 Peptide Neurotransmitters .....	132
11.1	肽类神经递质 Peptide neurotransmitters .....	132
11.2	几种神经肽 Some neuropeptides .....	136
12	一氧化氮, 自由基和细胞因子 Nitric Oxide, Free Radicals and Cytokines .....	141
12.1	一氧化氮 Nitric oxide .....	141



12.2 自由基 Free radicals .....	145
12.3 细胞因子 Cytokines .....	149

### III 神经和精神疾病治疗药物

#### Therapeutic Drugs of Neurological and Psychiatric Disorders

13 抗焦虑药和催眠药 Anxiolytic and Hypnotics .....	155
13.1 焦虑与失眠 Anxiety and insomnia .....	155
13.2 抗焦虑药和催眠药历史 History of anxiolytics and hypnotics .....	156
13.3 GABA <sub>A</sub> 受体与 BDZ 受体 GABA <sub>A</sub> receptors and BDZ receptors .....	157
13.4 苯二氮䓬类 Benzodiazepines .....	158
13.5 新型抗焦虑药和催眠药 Newer drugs for anxiety and insomnia .....	166
13.6 巴比妥类 Barbiturates .....	170
13.7 其它类型催眠药 Other hypnotics .....	174
14 抗癫痫药和抗惊厥药 Antiepileptic Drugs and Anticonvulsive Drugs .....	177
14.1 抗癫痫药 Antiepileptic drugs .....	177
14.2 抗惊厥药 Anticonvulsive drugs .....	188
15 抗抑郁药和抗躁狂药 Antidepressants and Antimanics .....	189
15.1 抗抑郁药 Antidepressants .....	189
15.2 主要的抗抑郁药 Major antidepressants .....	196
15.3 抗躁狂药 Antimanic drugs .....	200
16 抗精神病药 Antipsychotics .....	203
16.1 吩噻嗪类 Phenothiazine .....	203
16.2 硫杂蒯类 Thioxanthenes .....	209
16.3 丁酰苯类 Butyrophenones .....	211
16.4 二苯二氮䓬类 Dibenzodiazepines .....	214
16.5 苯丙异噁唑类 Benzisoxazoles .....	218
16.6 二苯丁酰哌啶类 Diphenylbutylpiperidine .....	220
16.7 吲哚类 Indolines .....	221
16.8 苯甲酰胺类 Benzamides .....	222
16.9 其它 Others .....	226
17 阿片类镇痛药及其拮抗剂 Opioid Analgesics and Antagonists .....	227
17.1 疼痛的病理生理学机制 Pathophysiological mechanisms of pain .....	227
17.2 阿片类镇痛药 Opioid analgesics .....	230
17.3 阿片受体拮抗剂 Opioid antagonists .....	246
18 解热镇痛药和抗炎药 Antipyretics-analgesic and Anti-inflammatory Drugs .....	249
18.1 解热镇痛药 Antipyretics-analgesic drugs .....	249

18.2 抗炎药 Anti-inflammatory drugs .....	254
19 抗偏头痛药 Anti-migraine Drugs .....	264
19.1 偏头痛的分型与机制 The classification and mechanism of migraine .....	264
19.2 缓解偏头痛发作的治疗药物 The therapeutic drugs for relieving attacks of migraine ....	266
19.3 预防偏头痛复发的治疗药物 The therapeutic drugs for prevention of migraine .....	275
20 全身麻醉药 General Anesthetics .....	281
20.1 吸入麻醉药 Inhaled anesthetics .....	281
20.2 静脉麻醉药 Intravenous anesthetics .....	301
21 局部麻醉药 Local Anesthetics .....	309
21.1 概述 Introduction .....	309
21.2 酯类局麻药 Ester local anesthetic .....	314
21.3 酰胺类局麻药 Amide local anesthetic .....	316
22 抗帕金森病药 Antiparkinsonism Drugs .....	320
22.1 抗帕金森病药物治疗的病理生理基础 Drug treatment for Parkinsonism pathogenesis .	320
22.2 影响多巴胺能神经类药 Drugs of acting dopaminergic pathways .....	324
22.3 中枢胆碱能受体阻断药 Muscarinic receptor antagonists in the central nervous system .....	331
23 治疗中枢神经系统退行性疾病药 Drugs of Treating CNS Degenerative Disease .....	333
23.1 治疗阿尔茨海默病药 Drugs of treating Alzheimer's disease .....	333
23.2 治疗亨廷顿病药 Drugs of treating Huntington disease .....	343
23.3 治疗脊髓侧索硬化症药 Drugs of treating amyotrophic lateral sclerosis .....	345
24 抗组胺药 Antihistamines .....	349
24.1 H <sub>1</sub> 受体阻断药 H <sub>1</sub> receptor blockers .....	349
24.2 H <sub>2</sub> 受体阻断药 H <sub>2</sub> receptor blockers .....	357
24.3 H <sub>3</sub> 受体阻断药 H <sub>3</sub> receptor blockers .....	360
25 肾上腺皮质激素和性激素 Adrenocortical Hormone and Sex Hormone .....	363
25.1 糖皮质激素 Glucocorticoids .....	363
25.2 盐皮质激素 Mineralcorticoid .....	375
25.3 皮质激素抑制药 Adrenocortical hormone inhibitors .....	376
25.4 促肾上腺皮质激素药 Adrenocorticotropin hormone .....	376
25.5 性激素 Sex hormones .....	377
26 中枢神经兴奋药与食欲抑制药 Central Nervous Stimulants and Appetite Suppressant .....	391
26.1 中枢神经兴奋药 Central nervous stimulants .....	391
26.2 食欲抑制剂 Appetite suppressant .....	409

27 维生素类和必需营养物质 Vitamins and Essential Nutritional Substances .....	414
27.1 维生素类 Vitamins .....	414
27.2 必需营养物质 Essential nutritional substances .....	424
28 尼古丁、咖啡因和乙醇依赖的药物治疗 Pharmacological Treatments for Nicotine、Caffeine and Alcohol Dependence .....	430
28.1 治疗尼古丁依赖的药物 Drugs of treating nicotine dependence .....	430
28.2 治疗乙醇依赖的药物 Drugs of treating alcohol dependence .....	433
28.3 咖啡因的依赖性及其中枢机制 Caffeine dependence and its neural mechanisms .....	435
29 药物成瘾性与对策 Drug Addiction and Countermeasures .....	437
29.1 概述 Introduction .....	437
29.2 致依赖性药物的分类 Classification of dependent drugs .....	438
29.3 药物依赖性的精神药理学 Psychopharmacology of drug dependence .....	439
29.4 药物依赖性的神经生物学 Neurobiology of drug dependence .....	439
29.5 药物依赖性的治疗 Therapeutics of drug dependence .....	442

## IV 中枢神经系统作用药物的实验方法 Experimental Methods of Drugs Acting on the CNS

30 镇痛药 Analgesics .....	453
30.1 化学刺激法 Chemical stimulus methods .....	453
30.2 热刺激法 Heat stimulus methods .....	454
30.3 神经源性疼痛 Neurogenic pain .....	455
31 镇静催眠药 Sedative and Hypnotic Drugs .....	459
31.1 间断性行为实验观察方法 Method of intermittent observation .....	459
31.2 开场实验 Open field test .....	459
31.3 孔板实验 Hole board test .....	459
31.4 遥测分析大鼠大脑 EEG EEG analysis from rat brain by telemetry .....	460
31.5 巴比妥类药物的协同作用 Synergic action of barbiturates .....	460
31.6 大鼠足休克引发的失眠实验 Footshock induced insomnia in rats .....	461
31.7 记录清醒猫 EEG ——睡眠成分分析实验 EEG registration in conscious cats — analysis of sleep stage .....	462
32 抗癫痫药 Antiepileptic Drugs .....	464
32.1 急性单纯部分性发作模型 Acute simple partial seizure models .....	464
32.2 慢性单纯部分性发作模型 Chronic simple partial seizure models .....	465
32.3 复杂部分性发作模型 Complex partial seizure models .....	465
32.4 脑片模型和单细胞模型 Brain slice models and single-cell models .....	466

32.5	原发性癫痫发作的模型 Primary epileptic seizure models	466
33	抗焦虑药 Anxiolytics	468
33.1	非条件反射焦虑模型 Non-conditioning response based anxiety models in animals	468
33.2	条件反射焦虑模型 Conditioning response based anxiety models in animals	472
34	抗精神病药 Antipsychiatrics	475
34.1	苯丙胺模型 Amphetamine-induced behavioed model	475
34.2	苯环利定模型 Phencyclidine-induced behavioed model	475
34.3	阿扑吗啡模型 Apomorphine-induced behavioed model	476
34.4	僵住反应模型 Catalepsy animal model	476
34.5	潜伏抑制模型 Latent inhibition model	476
34.6	惊跳反应预刺激抑制模型 Prepulse inhibition model	477
34.7	海马腹侧损毁模型 Ventral hippocampus-damaged animal model	477
35	抗痴呆药 Anti-dementia Drugs	479
35.1	A $\beta$ 致痴呆模型 A $\beta$ -produced dementia animal model	479
35.2	APP 转基因小鼠 APP transgenic mice	480
35.3	老化致痴呆模型 Aging dementia animal model	480
35.4	胆碱能损伤致痴呆模型 Dementia animal model induced by impaired cholinergic function	481
35.5	慢性脑缺血致痴呆模型 Dementia animal model induced by chronic cerebral ischemia	481
35.6	检测指标及方法 Detecting methods	482
36	抗抑郁药 Antidepressants	485
36.1	强迫游泳实验 Forced swimming test	485
36.2	小鼠悬尾实验 Tail suspension test	485
36.3	利血平诱导体温下降 Reserpine-induced hypothermia	486
36.4	获得性无助 Learned helplessness	486
36.5	未预知的长期应激刺激 Chronic unpredictable stress	486
36.6	大鼠嗅球切除抑郁症模型 Olfactory bulbectomy rat as a model of depression	487
37	抗帕金森病药 Antiparkinson's Disease Drugs	489
37.1	整体实验动物模型 Animal models in vivo experiments	489
37.2	离体实验方法 Empirical methods in vitro	491
38	麻醉药 Anesthetics	492
38.1	局部麻醉药实验法 Experimental methodology of local anesthetics	492
38.2	全身麻醉药实验法 Experimental methodology of general anesthetics	493

39 抗脑缺血损伤药 Anti-cerebral Ischemia Injury Drugs .....	495
39.1 全脑缺血模型 Global cerebral ischemia models .....	495
39.2 局部脑缺血模型 Focal cerebral ischemia models .....	497
39.3 其他脑缺血模型 Other cerebral ischemia models .....	499
40 治疗药物成瘾药 Drugs Treating Drug Addiction .....	500
40.1 躯体依赖性实验 Physical dependence test .....	500
40.2 精神依赖性实验 Psychotic dependence test .....	501
40.3 行为敏化 Behavioral sensitization .....	502
40.4 动物离体组织阿片依赖模型 Model of opiate dependence in animal isolated tissues .....	503
41 神经系统疾病相关的转基因和基因敲除动物模型研究 The Study of Transgenic and Gene Knockout Animal Models Related with Disease of Neural System .....	504
41.1 概述 Introduction .....	504
41.2 转基因动物模型 Transgenic animal model .....	504
41.3 基因敲除动物模型 Gene knockout animal model .....	505
41.4 中枢神经系统疾病相关的转基因和基因敲除动物模型 Transgenic and gene knockout animal models related with disease of central neural system .....	507

## V 综合征解释 Explanation of Syndromes

42 神经病学与精神病学综合征 The Syndromes in Neurology and Psychiatry .....	513
42.1 神经病学综合征 The syndromes in neurology .....	513
42.2 精神病学综合征 The syndromes in psychiatry .....	521
索引 .....	534

# 基本概念

Basic Concepts

# I



# 1 药理学的基本原理

## Principles of Pharmacology

### 1.1 药理学的定义及任务

#### Definition and role of pharmacology

药理学 (pharmacology) 是研究药物与机体之间相互作用的科学, 一方面研究机体如何对药物进行处置, 称作药物代谢动力学 (pharmacokinetics), 简称药动学; 另一方面研究药物如何对机体发挥作用, 称作药物效应动力学 (pharmacodynamics), 简称药效学。

药理学的主要任务是阐明药物作用机制, 提高药物的疗效, 开发新药, 发现药物新用途, 并为探索生理、生化及病理过程提供实验资料。

药理学是建立在实验基础上的科学, 在整

体、器官、组织、细胞和分子水平, 观察药物的作用及其作用原理。所以在药理作用及机制的介绍中, 要涉及这些方面的研究进展。

临床药理学是以临床病人为研究对象, 研究药物的药效学、药动学和药物的不良反应, 并对药物的疗效和安全性进行评价, 以确保合理用药。神经精神药理学 (neuropsychopharmacology) 重点介绍治疗神经和精神疾病的药物, 并提供了解疾病的病理生理、病理解剖和药物的作用原理等相关的基础知识。

### 1.2 药物的处置

#### Drug disposition

药物的体内过程亦称药物处置 (drug disposition) 过程, 包括吸收、分布、代谢和排泄。药物从用药部位进入体循环的过程称为吸收 (absorption); 吸收后的药物随着血液循环进入各器官、组织及细胞内的过程称为分布 (distribution); 药物在体内经受药酶作用发生结构变化, 生成多种代谢物的过程称为代谢 (metabolism) 或生物转化 (biotransformation); 药物以原形或代谢物的形式排出体外的过程称为排泄 (excretion)。生物转化和排泄两大过程主要反映药物从循环或体内的消失, 统称为消除 (elimination)。

药物代谢动力学是应用动力学 (kinetics) 原理, 研究药物在体内吸收、分布和消除过程

的动态变化, 并运用数学方程定量描绘。

#### 1.2.1 吸收

吸收系指药物从用药部位向血液循环转运的过程, 大多数药物通过被动转运方式吸收入血。药物的吸收速度和程度直接影响到作用起始时间和作用强弱。影响药物吸收的因素有多种, 如药物的理化性质、给药途径和药物剂型等。

药物的理化性质, 如药物的脂溶性、解离度和分子大小等决定药物的吸收速度和程度。药物的脂溶性越高越容易吸收, 也越容易透过血脑屏障 (blood brain barrier, BBB) 进入中枢神经系统发挥治疗作用。最容易影响药物脂溶性的方法是调节用药部位的 pH 值, 这样就



可以影响到药物的解离度，解离度越低脂溶性越高，反之亦然。

大多数的药物不是弱酸性就是弱碱性，真正属于中性的药物如氯化钠等比较少，因此适当调整用药部位的pH值就可以明显改变药物的脂溶性和吸收度。其解离特性以 $pK_a$ 表示，这种特性及其影响可用Handerson-Hasselbalch公式说明。公式中弱酸性药物为HA，弱碱性药物为B， $K_a$ 为解离常数。

### pH 值影响吸收

弱酸性药物，符合下述公式：

$$pH - pK_a = \lg[A^-] / [HA]$$

公式中的pH是指药物所在环境（溶液）的酸碱度， $pK_a$ 是该药物固有的解离特性，数值相当于50%解离时溶液的pH值。HA为原型药， $A^-$ 为解离型药物。当pH值降低1，则脂溶性会增大10倍。

弱碱性药物，符合下述公式：

$$pK_a - pH = \lg[BH^+] / [B]$$

B为原型药， $BH^+$ 为解离型药物。当pH值增加1，则脂溶性会增大10倍。

### 给药途径影响药物吸收

常用给药途径有口服（oral administration, per os, p.o），舌下（sublingual），直肠（per rectum），皮肤、粘膜给药（per cutaneous or

mucosal administration），包括皮肤、眼睛、阴道及鼻粘膜给药；吸入（inhalation）；肌肉注射（intramuscular injection）和皮下注射（subcutaneous injection）；静脉注射（intravenous injection）和椎管注射（intrathecal injection）等（图1-1）。除静脉注射和椎管注射外，其他给药途径都存在不同的吸收过程。通常认为，吸入、舌下、粘膜给药、肌肉和皮下注射时，药物均可通过不同部位毛细血管进入血循环，药物吸收较快且较完全。口服次之，皮肤吸收较差。

口服后的药物首先通过胃和肠道粘膜吸收，然后通过门静脉和肝脏进入体循环。某些药物在通过胃肠道和肝脏时可被肠道内的酶和肝细胞内各种药物代谢酶催化进行生物转化，使原形药进入体循环的量明显下降，此过程称为“首关效应”（first-pass effect）。舌下、直肠给药及其他非血管给药，其吸收过程均不经过门静脉和肝脏，避免首关效应，可提高药物生物利用度。

### 药物剂型和制剂影响吸收

常用的药物剂型有片剂、胶囊剂、注射剂等；外用剂型有软膏剂、霜剂、滴眼剂等；特殊剂型有速释、缓释、控释和脂质体制剂等。它们均可不同程度地改变药物的吸收速度和程度，如控释制剂可按一定比例在消化道释放出

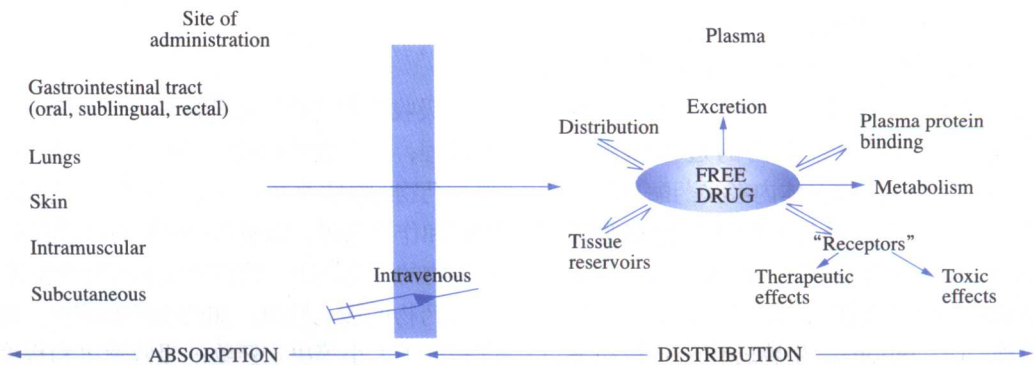


图 1-1 给药途径、吸收和分布

Site of administration 给药部位，Gastrointestinal tract 胃肠道，oral 口服，sublingual 舌下，rectal 直肠，Lungs 肺，Skin 皮肤，Intramuscular 肌内，Subcutaneous 皮下，Intravenous 静脉内，Plasma 血浆，Excretion 排泄，Plasma protein binding 血浆蛋白结合，Metabolism 代谢，Tissue reservoirs 组织储存，Receptors 受体，Therapeutic effect 治疗作用，Toxic effects 毒性作用，Absorption 吸收，Distribution 分布