

医药高等职业院校教材

Yaolixue

# 药理学

• Yaolixue

■主编  
李长龄 杨燕琼

北京医科大学出版社

医药高等职业院校教材

# 药 理 学

主 编 李长龄 杨燕琼

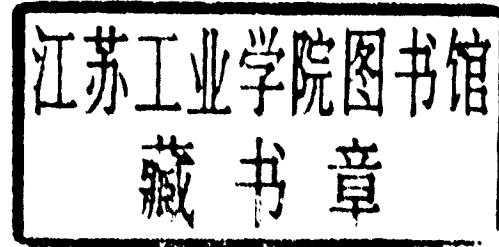
编写人员 (按姓氏笔画为序)

王令玺 (北京医药总公司职工大学)

王 晶 (北京中医药大学)

叶 加 (北京大学药学院)

李长龄 (北京大学药学院)



北京医科大学出版社

# YAO LI XUE

## 图书在版编目 (CIP) 数据

药理学/李长龄, 杨燕琼主编. —北京: 北京医科大学出版社, 2001.8

ISBN 7-81071-236-5

医药高等职业院校教材

I . 药… II . ①李… ②杨… III . 药理学

IV . R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2001) 第 056146 号

北京医科大学出版社出版发行

(100083 北京市海淀区学院路 38 号 北京大学医学部院内)

责任编辑: 王凤廷

责任校对: 王怀玲 焦 媛

责任印制: 郭桂兰

山东省莱芜市圣龙印务书刊有限责任公司印刷 新华书店经销

开本: 787mm×1092mm 1/16 印张: 16.75 字数: 422 千字

2001 年 8 月第 1 版 2001 年 8 月第 1 次印刷 印数: 1-5000 册

定价: 23.80 元

版权所有 不得翻印

## 前　　言

为配合高等职业教育的发展，大力推进高等职业教育人才培养模式的改革，加强教材的建设，北京大学药学院、海淀走读大学、北京军医学院、北京中医药大学、北京医药总公司职工大学等几所医药院校药理教研室的同志们遵循教育部关于加强高职高专教育人才培养工作意见的总体思想，针对经济发展对高职人才的需求，按照我国医药卫生事业发展的需要编写了这本药理学教材。

本教材是根据医药学高职教育学生的培养目标和教学大纲，在总结各院校教学经验，并参考相关教材的基础上编写而成。本书的编写既考虑作为教材的科学性、系统性，又兼顾了实用性、先进性。内容安排注重少而精，但又保证基本理论和基本知识的阐述。

本书适用于医学、药学高等职业教育及大专层次的成人高等教育学生教学使用，也可供广大医药技术管理人员参考使用。教师可根据专业特点和教学时数，安排组织讲授。

由于我们的水平和能力有限，书中一定存在不少缺点和不足之处，恳请广大师生和读者给予批评和指正。

李长龄　杨燕琼  
2001年8月

# 目 录

<b>第一章 绪言</b> .....	(1)
一、药理学研究的内容和任务.....	(1)
二、药理学的发展简史.....	(1)
<b>第二章 药物对机体的作用——药效学</b> .....	(3)
一、药物的作用.....	(3)
二、药物作用的基本规律.....	(3)
三、药物作用的原理.....	(6)
<b>第三章 机体对药物的作用——药动学</b> .....	(8)
一、药物的跨膜转运.....	(8)
二、药物的吸收.....	(9)
三、药物的分布 .....	(10)
四、药物的代谢(生物转化) .....	(11)
五、药物的排泄 .....	(12)
六、药代动力学基本概念 .....	(12)
<b>第四章 影响药物作用的因素</b> .....	(17)
第一节 机体方面的因素 .....	(17)
一、年龄 .....	(17)
二、性别 .....	(17)
三、精神因素与病理状态 .....	(17)
四、遗传因素 .....	(18)
第二节 药物方面的因素 .....	(18)
一、药物的剂量 .....	(18)
二、药物的剂型 .....	(18)
三、给药途径、给药时间和次数 .....	(19)
四、长期连续用药 .....	(19)
第三节 联合用药 .....	(20)
一、药动学方面的影响 .....	(20)
二、药效学方面的影响 .....	(21)
<b>第五章 新药研究与开发</b> .....	(22)
第一节 发现新的生物活性物质的途径 .....	(22)
一、筛选 .....	(22)
二、构效关系 .....	(23)
三、偶然发现 .....	(23)
第二节 与治疗作用有关的主要药效学研究 .....	(23)
第三节 一般药理研究 .....	(24)

<b>第四节 毒理学研究</b>	.....	(24)
一、急性毒性研究	.....	(24)
二、长期毒性研究	.....	(25)
三、特殊毒理研究	.....	(25)
<b>第五节 药代动力学研究</b>	.....	(25)
<b>第六章 传出神经系统药理概论</b>	.....	(27)
<b>第一节 传出神经系统的分类</b>	.....	(27)
一、传出神经按解剖特征分类	.....	(27)
二、传出神经按释放递质分类	.....	(27)
<b>第二节 递质的合成、贮存、释放与代谢</b>	.....	(28)
一、乙酰胆碱	.....	(28)
二、去甲肾上腺素	.....	(28)
<b>第三节 传出神经系统的受体及效应</b>	.....	(29)
一、传出神经系统的受体	.....	(29)
二、传出神经系统的效应	.....	(30)
<b>第四节 传出神经系统药物的作用方式和分类</b>	.....	(31)
一、传出神经系统药物的作用方式	.....	(31)
二、传出神经系统药物的分类	.....	(32)
<b>第七章 拟胆碱药</b>	.....	(33)
<b>第一节 M胆碱受体激动药</b>	.....	(33)
<b>第二节 抗胆碱酯酶药及胆碱酯酶复活药</b>	.....	(34)
一、抗胆碱酯酶药	.....	(34)
二、胆碱酯酶复活药	.....	(36)
<b>第八章 抗胆碱药</b>	.....	(38)
<b>第一节 M胆碱受体阻断药</b>	.....	(38)
<b>第二节 N胆碱受体阻断药</b>	.....	(40)
一、N <sub>1</sub> 胆碱受体阻断药	.....	(40)
二、N <sub>2</sub> 胆碱受体阻断药	.....	(41)
<b>第九章 拟肾上腺素药</b>	.....	(43)
<b>第一节 α和β受体激动药</b>	.....	(43)
<b>第二节 α受体激动药</b>	.....	(46)
<b>第三节 β受体激动药</b>	.....	(47)
<b>第十章 抗肾上腺素药</b>	.....	(49)
<b>第一节 α受体阻断药</b>	.....	(49)
一、α <sub>1</sub> 、α <sub>2</sub> 受体阻断药	.....	(49)
二、α <sub>1</sub> 受体阻断药	.....	(50)
<b>第二节 β受体阻断药</b>	.....	(51)
<b>第三节 α、β受体阻断药</b>	.....	(52)
<b>第十一章 局部麻醉药</b>	.....	(54)
<b>第十二章 全身麻醉药</b>	.....	(57)

一、吸入性麻醉药	(57)
二、静脉麻醉药	(59)
三、复合麻醉	(59)
<b>第十三章 镇静催眠药</b>	<b>(61)</b>
一、苯二氮草类	(61)
二、巴比妥类	(62)
三、其它镇静催眠药	(63)
<b>第十四章 抗癫痫药及抗惊厥药</b>	<b>(65)</b>
一、抗癫痫药	(65)
二、抗惊厥药	(67)
<b>第十五章 抗精神失常药</b>	<b>(69)</b>
一、抗精神分裂症药	(69)
二、抗躁狂症与抗抑郁症药	(71)
<b>第十六章 抗震颤麻痹药</b>	<b>(75)</b>
一、中枢性多巴胺药	(75)
二、中枢性抗胆碱药	(76)
<b>第十七章 镇痛药</b>	<b>(77)</b>
第一节 阿片生物碱类镇痛药	(77)
第二节 人工合成镇痛药	(79)
第三节 非麻醉性镇痛药	(81)
<b>第十八章 中枢兴奋药</b>	<b>(82)</b>
一、主要兴奋大脑皮层的药物	(82)
二、主要兴奋延脑呼吸中枢的药物	(83)
<b>第十九章 解热镇痛抗炎药及抗痛风药</b>	<b>(85)</b>
第一节 解热镇痛抗炎药	(85)
一、概述	(85)
二、常用药物	(86)
第二节 抗痛风药	(89)
<b>第二十章 抗心律失常药</b>	<b>(91)</b>
第一节 正常心肌电生理	(91)
一、心肌细胞膜电位	(91)
二、自律性	(92)
三、膜反应性	(92)
四、有效不应期 (ERP)	(92)
第二节 抗心律失常药的作用机制和分类	(92)
一、心律失常的形成	(92)
二、抗心律失常药作用机制	(94)
三、抗心律失常药的分类	(94)
第三节 常用抗心律失常药	(95)
第四节 快速型心律失常的药物选用	(101)

<b>第二十一章 抗慢性心功能不全药</b>	.....	(104)
第一节 强心苷	.....	(104)
第二节 非强心苷类正性肌力药	.....	(110)
第三节 减负荷药	.....	(110)
一、利尿药	.....	(110)
二、血管舒张药	.....	(111)
<b>第二十二章 抗心绞痛与调血脂药</b>	.....	(112)
第一节 抗心绞痛药	.....	(112)
一、有机硝酸酯类	.....	(112)
二、β受体阻断药	.....	(114)
三、钙拮抗药	.....	(115)
第二节 调血脂药	.....	(115)
一、主要降低甘油三酯药	.....	(116)
二、主要降低胆固醇药	.....	(117)
三、HMG-CoA还原酶抑制剂	.....	(118)
四、其他	.....	(118)
<b>第二十三章 抗高血压药</b>	.....	(120)
第一节 抗高血压药分类	.....	(120)
第二节 常用抗高血压药	.....	(121)
一、交感神经阻滞药	.....	(121)
二、血管舒张药	.....	(124)
三、影响血管紧张素Ⅱ形成和作用药	.....	(126)
四、利尿降压药	.....	(128)
第三节 抗高血压药应用原则	.....	(128)
<b>第二十四章 利尿药与脱水药</b>	.....	(130)
第一节 利尿药	.....	(130)
一、利尿药作用的生理学基础	.....	(130)
二、常用利尿药	.....	(131)
第二节 脱水药	.....	(133)
<b>第二十五章 作用于血液系统药物</b>	.....	(135)
第一节 抗贫血药	.....	(135)
一、铁制剂	.....	(135)
二、叶酸	.....	(135)
三、维生素B <sub>12</sub>	.....	(136)
四、红细胞生成素	.....	(136)
第二节 抗凝血药和促凝血药	.....	(137)
一、抗凝血药	.....	(137)
二、促凝血药	.....	(138)
第三节 血容量扩充剂	.....	(138)
<b>第二十六章 消化系统药</b>	.....	(141)

<b>第一节 助消化药</b>	.....	(141)
<b>第二节 抗消化性溃疡药</b>	.....	(141)
一、抗酸药	.....	(141)
二、胃酸分泌抑制药	.....	(142)
<b>第三节 泻药和止泻药</b>	.....	(143)
一、泻药	.....	(143)
二、止泻药	.....	(143)
<b>第四节 止吐药</b>	.....	(144)
<b>第五节 肝胆疾病用药</b>	.....	(144)
一、胆石溶解药	.....	(144)
二、促进胆汁分泌药	.....	(145)
三、治疗肝昏迷药	.....	(145)
<b>第二十七章 呼吸系统药</b>	.....	(148)
<b>第一节 平喘药</b>	.....	(148)
一、肾上腺素受体激动剂	.....	(148)
二、茶碱类	.....	(149)
三、肾上腺皮质激素	.....	(150)
四、过敏介质释放阻滞药	.....	(150)
<b>第二节 祛痰药</b>	.....	(151)
<b>第三节 镇咳药</b>	.....	(151)
一、中枢性镇咳药	.....	(151)
二、外周性镇咳药	.....	(152)
<b>第二十八章 组胺受体阻断药</b>	.....	(154)
<b>第一节 H<sub>1</sub>受体阻断药</b>	.....	(154)
<b>第二节 H<sub>2</sub>受体阻断药</b>	.....	(155)
<b>第二十九章 子宫兴奋药</b>	.....	(157)
<b>第三十章 肾上腺皮质激素类药</b>	.....	(160)
<b>第一节 盐皮质激素</b>	.....	(161)
<b>第二节 糖皮质激素</b>	.....	(161)
<b>第三节 促皮质素及皮质激素抑制药</b>	.....	(164)
一、促皮质素	.....	(164)
二、皮质激素抑制药	.....	(164)
<b>第三十一章 性激素类药和避孕药</b>	.....	(166)
<b>第一节 性激素类药</b>	.....	(166)
一、雌激素类药及抗雌激素类药	.....	(166)
二、孕激素类药	.....	(167)
三、雄激素类药	.....	(168)
四、同化激素类药	.....	(168)
<b>第二节 避孕药</b>	.....	(169)
一、主要抑制排卵的药物	.....	(169)

二、抗孕卵着床的药物	(170)
<b>第三十二章 甲状腺激素和抗甲状腺药</b>	(172)
第一节 甲状腺激素	(172)
第二节 抗甲状腺药	(173)
一、硫脲类	(173)
二、碘和碘化物	(174)
三、放射性碘	(174)
<b>第三十三章 胰岛素与口服降血糖药</b>	(176)
第一节 胰岛素	(176)
第二节 口服降血糖药	(177)
一、磺酰脲类	(177)
二、双胍类	(178)
三、 $\alpha$ -葡萄糖苷酶抑制剂	(178)
<b>第三十四章 维生素及微量元素药</b>	(180)
第一节 维生素	(180)
一、水溶性维生素	(180)
二、脂溶性维生素	(182)
第二节 微量元素类药	(184)
<b>第三十五章 抗菌药物概论</b>	(186)
<b>第三十六章 喹诺酮类、磺胺类及其它合成抗菌药</b>	(188)
第一节 喹诺酮类药物	(188)
第二节 磺胺类药物	(190)
第三节 其它合成抗菌药	(192)
一、甲氧苄氨嘧啶	(192)
二、硝基呋喃类药	(192)
<b>第三十七章 <math>\beta</math>-内酰胺类抗生素</b>	(194)
第一节 青霉素类	(194)
一、窄谱青霉素类	(194)
二、广谱青霉素类	(196)
第二节 头孢菌素类	(196)
第三节 非典型 $\beta$ -内酰胺类	(198)
<b>第三十八章 大环内酯类、林可霉素类及其它抗生素</b>	(200)
第一节 大环内酯类抗生素	(200)
第二节 林可霉素和克林霉素	(201)
第三节 万古霉素和去甲万古霉素	(201)
<b>第三十九章 氨基苷类与多肽类抗生素</b>	(203)
第一节 氨基苷类抗生素	(203)
第二节 多肽类抗生素	(205)
<b>第四十章 四环素类与氯霉素</b>	(207)
第一节 四环素类	(207)

<b>第二节 氯霉素</b>	.....	(208)
<b>第四十一章 抗真菌药与抗病毒药</b>	.....	(210)
第一节 抗真菌药	.....	(210)
第二节 抗病毒药	.....	(211)
<b>第四十二章 抗结核病药及抗麻风病药</b>	.....	(214)
第一节 抗结核病药	.....	(214)
一、一线抗结核药	.....	(214)
二、二线抗结核药	.....	(216)
三、抗结核病药应用原则	.....	(217)
第二节 抗麻风病药	.....	(217)
<b>第四十三章 抗寄生虫药</b>	.....	(219)
第一节 抗疟药	.....	(219)
一、抗疟药的作用环节与分类	.....	(219)
二、常用抗疟药	.....	(220)
第二节 抗阿米巴病药和抗滴虫病药	.....	(222)
一、抗阿米巴病药	.....	(222)
二、抗滴虫病药	.....	(224)
第三节 抗血吸虫病药和抗丝虫病药	.....	(224)
一、抗血吸虫病药	.....	(224)
二、抗丝虫病药	.....	(225)
第四节 抗肠虫病药	.....	(226)
一、广谱抗肠虫药	.....	(226)
二、其它抗肠虫药	.....	(227)
<b>第四十四章 消毒防腐药</b>	.....	(230)
第一节 常用药物	.....	(230)
一、醇类	.....	(230)
二、酚类	.....	(230)
三、醛类	.....	(231)
四、酸类	.....	(231)
五、氧化剂	.....	(232)
六、卤素类	.....	(232)
七、重金属盐类	.....	(233)
八、表面活性剂	.....	(234)
九、染料类	.....	(234)
十、其它	.....	(234)
第二节 清毒防腐药的选择	.....	(235)
<b>第四十五章 抗恶性肿瘤药</b>	.....	(236)
第一节 肿瘤细胞增殖周期与药物治疗的关系	.....	(236)
第二节 抗恶性肿瘤药的作用机制与分类	.....	(237)
第三节 常用抗肿瘤药物	.....	(238)

一、干扰核酸合成的药物	(238)
二、破坏DNA结构和功能的药物	(239)
三、影响蛋白质合成的药物	(240)
四、影响体内激素平衡的药物	(241)
第四节 抗肿瘤药物的联合应用	(242)
第四十六章 影响免疫功能药	(245)
第一节 免疫抑制剂	(245)
第二节 免疫增强剂	(245)
药名英文索引	(247)

# 第一章 緒 言

## 一、药理学研究的内容和任务

药物 (drug) 是指用于预防、诊断、治疗疾病和用于计划生育的各种化学物质。这些物质可能来源于植物、动物、矿物或人工合成，也可能来源于生物工程技术。(它们在一定的剂量范围内能够对机体(包括病原体)产生某种作用，使机体的生理功能或病理过程发生改变，从而达到防治疾病的目的)

药理学 (pharmacology) 是研究药物与机体(含病原体)之间的相互作用，着重阐明应用药物防治疾病的规律及其道理的一门科学。它一方面研究药物对机体或病原体的作用规律和作用机理；另一方面研究机体对药物的影响，即研究药物在机体内的吸收、分布、生物转化和排泄等过程。前者称为药物效应动力学 (pharmacodynamics)，即药效学；后者称为药物代谢动力学 (pharmacokinetics)，即药动学。

药效学和药动学在体内是同时进行并互相影响的。对这两者的研究和阐明有助于临床合理用药，充分发挥药物的防治作用，避免或减轻不良反应，同时也为寻找新药和整理提高中草药提供线索和科学依据。

药理学与基础医学、临床医学、药学有着广泛而密切的联系。它在生理学、解剖学、生物化学、病理生理学、微生物学等基础医学研究进展的基础上，运用药物化学、生药学、解剖学、分析化学等药学学科的基础理论和知识，阐明药物的作用、临床应用、不良反应和体内过程等。

药理学是一门实验性的科学，可以用健康动物在整体组织器官，细胞及分子等不同水平进行实验，观察药物的作用；也可以用动物或组织器官复制病理模型，进行实验，观察药物的治疗作用；还可以在充分的动物实验的基础上，观察药物对人体的作用。

学习药理学应运用辩证唯物主义观点，分析药物与机体间的相互作用，认识到药物仅是影响疾病转化的重要条件，机体则是决定疾病转归的内在因素。学习药理学就要熟悉药物的基本作用，并在此基础上掌握药物按药理作用的分类方法，以及各类代表药物的作用、作用机制、临床应用、不良反应、药动学特点等，以便在防治疾病的过程中，充分发挥药物的治疗作用，尽量减少其不良反应。在掌握代表药物作用特点的基础上举一反三，确保临床用药的安全性和有效性。

药理学发展迅速，新的药物不断出现。因此，我们的药理学知识需要不断地更新和补充。通过药理学的学习，我们应掌握查阅药理学文献、资料和参考书的方法，为培养自学能力打好基础，以便为今后学习更多、更新的药学知识，以适应药理学和新药研究的迅速发展。

## 二、药理学的发展简史

在远古时代，人类在与疾病作斗争的过程中发现和认识药物，并经过世代相传，逐渐积累了有关药物的知识。随着医疗实践的不断发展，出现了专门记载药物知识的书籍，称为本

草学或药物学。早在公元 1 世纪，我国就出版了本草书籍《神农本草经》，这是我国最早的一部药学名著，她总结了我国古代劳动人民所积累的药学知识，收载药物 365 种，其中大部分至今仍在使用，如大黄、麻黄、常山、海藻等。此后，对药物学书籍不断增补修订，使其内容日益丰富，分类愈益科学。历代药物学（本草学）书籍中较重要的有《本草经集注》（公元六世纪）、《新修本草》（公元七世纪）、《经史证类备急本草》（公元十二世纪）、《本草纲目》（公元十二世纪）、《本草纲目拾遗》（公元十八世纪）等。其中《新修本草》收载药物 884 种，于公元 659 年由唐朝政府正式颁布，是我国最早的一部药典，也是世界上最早的一部药典。《本草纲目》是我国明朝伟大的药物学家李时珍通过长期的行医、采药、调查、考证、总结用药经验，历时 26 年写出的闻名世界的药物学巨著，全书 52 卷，约 190 万字，收载药物 1 892 种。该书内容丰富，分类科学，受到国际医药界的广泛重视，已被译成英、日、法、朝、俄、拉丁等外国文字，传播到世界各地，成为世界的重要药物学文献之一。

在药学发展的过程中，虽然早就积累了一些药理知识，但药理学成为一门现代科学还是从 19 世纪才开始的。当时，由于化学、生物学、生理学的发展，德国 FW Sertürner 首先从阿片中提出（1804）吗啡，并用狗证实了它的镇痛作用。1819 年到 1856 年，法国 FF Megendie 和 Bernald 等用青蛙进行实验，分别证明士的宁作用于脊髓，筒箭毒碱作用于神经肌肉接头，为实验药理学的建立奠定了基础。

近年来，随着相关学科的迅猛发展和新技术不断引入，使药理学研究在深度和广度方面都得到很大发展。如对药物作用机制的研究，已由原来的整体、组织、器官水平深入到细胞、亚细胞、受体、分子水平。药理学科也出现了很多分支，如神经药理学、心血管药理学、抗炎免疫药理学、抗感染药理学、分子药理学、生化药理学、遗传药理学、时辰药理学、临床药理学等。这些分支学科的建立和发展，大大充实与丰富了药理学研究的内容。

我国于 20 世纪早期开始了现代药理学的教学和研究工作，并取得了一定成绩。新中国成立后，药理学的教学和科研工作得到较大发展，尤其在中草药研究方面取得重大成就，如在茛菪类药物中研制了山茛菪碱和东茛菪碱；在延胡索中提取了镇痛药延胡索乙素；从青蒿中提取出抗疟药青蒿素，并研制出黄夹苷治疗心功能不全，常咯啉用于心律失常，棉酚用于男性节育，五味子素治疗肝炎等。此外，在抗心绞痛药，活血化瘀药，抗恶性肿瘤药等方面的研究也都有一定的特色，并达到较高的科学水平，为我国的医药事业做出了巨大贡献。

（李长龄）

## 第二章 药物对机体的作用——药效学

### 一、药物的作用

药物对机体的作用，即药物作用（drug action）是指药物与机体组织、细胞间的原发作用。这些作用表现为在药物影响下机体组织、器官原有功能所发生的改变，这也称为药物效应（drug effect）。但在实际应用中，药物作用与药物效应常相互通用。药物不能使机体产生新的功能，只能在机体原有功能的基础上加以调节，即药物对机体功能活动的影响可表现为功能活动的加强或减弱。机体生理、生化功能的加强称为兴奋（excitation），如咖啡因能提高中枢神经系统的功能活动，肾上腺素能增强心脏的活动。凡能引起兴奋作用的药物称为兴奋药（excitants）。机体生理生化功能的减弱称为抑制（inhibition），如镇静催眠药能使中枢神经系统的功能活动降低，阿托品能使胃肠平滑肌松弛等。凡能引起抑制作用的药物称为抑制药（inhibitors）。

另有一些药物可补充机体的不足，如维生素、激素等。还有一些药物并不影响机体的功能，只是用于诊断疾病，如各种造影剂。

### 二、药物作用的基本规律

药物的作用是复杂的，其表现形式是多种多样的，但也有很多共同之处，可总结出下列药物作用的一般规律。

#### （一）药物的选择性作用

选择性作用是指药物进入机体后，并不是对所有的组织器官都同等起作用，只对少数组织或器官发生较明显的作用，而对其它组织或器官的作用不明显，或完全没有作用。例如，缩宫素对子宫平滑肌的兴奋作用较强，全身麻醉药对中枢神经系统的抑制作用较突出，抗菌药物对病原微生物的抑制或杀灭作用比较明显等。由于大多数药物都具有各自的选择性作用，作用于一定的组织器官，引起特定的功能改变，所以它们各有不同的适应证和毒性，这就构成了药物分类的依据和选择用药的基础。药物的选择性作用一般是相对的，这和用药剂量有关。某些药物小剂量时，只作用于个别组织器官，大剂量时则能引起较多组织器官反应。

产生选择性作用的原因，可能与药物的化学结构、药物在体内的分布、药物与受体的结合以及组织器官对药物的敏感性有关。一般地说，生化反应系统越是复杂的器官（例如脑和肝等），越易受到药物的影响，对药物的敏感性也越高。

#### （二）局部作用和吸收作用

局部作用是指药物被吸收入血之前，在用药部位所出现的作用。例如碘或甲紫溶液用于皮肤表面的消毒作用。吸收作用是指药物被吸收入血以后，随着血液循环分布到全身各组织、器官后出现的作用，例如硝酸甘油的抗心绞痛作用，阿司匹林的退热、镇痛作用。吸收

作用的范围较广，可涉及到全身各个部位，所以也称为全身作用，但由于药物作用的选择性，可只对某些敏感部位发挥较明显的作用。

### (三) 防治作用和不良反应

药物对机体既可呈现有利的防治作用，也可引起有害的不良反应，这表现了药物作用的两重性。

1. 防治作用 可分为预防作用和治疗作用。

(1) 预防作用：是指提前用药以防止疾病或症状发生的药物作用，如口服用乙胺嘧啶预防疟疾，使用维生素D预防佝偻病、骨软化症等。

(2) 治疗作用：是指药物所产生的与用药目的一致的作用，一般可分为对症治疗和对因治疗。前者主要是减轻或消除疾病症状，如失眠患者服用催眠药，发烧患者应用解热药等。后者主要是消除致病原因，如应用抗菌药治疗细菌性感染。通常对因治疗比对症治疗重要，但在某些情况下，如病因未明或对因治疗未能生效，需立即控制症状，以减轻病情。例如病人处于休克、惊厥或急性哮喘时，必须立即采用对症治疗药物，以缓解症状，防止病情恶化，此时，对症治疗较之对因治疗就更为迫切。

2. 不良反应 是指用药后出现的与用药目的不相符的，并且对机体不利的反应。不良反应可分为以下几种：

(1) 副作用 (side reaction)：是指药物在治疗量时引起的与防治作用无关的作用。它给病人带来不适，但一般都比较轻微，危害不大。例如沙丁胺醇可治疗支气管哮喘，但同时也可兴奋骨骼肌引起肌肉震颤。阿托品具有松弛平滑肌和抑制腺体分泌的作用，当利用其松弛平滑肌作用，缓解胃肠平滑肌痉挛治疗胃肠绞痛时，可出现唾液腺分泌减少，造成口干的副作用。

(2) 毒性反应 (toxic reaction)：一般是由于用药剂量过大，或用药时间过久，所发生的对机体有明显损害的反应。有时病人对某些药物特别敏感，使用治疗剂量亦可出现毒性反应。毒性反应可表现在中枢神经系统（头痛、头晕、精神失常等）、消化系统（恶心、呕吐、腹痛、腹泻等）、心血管系统（心律失常、血压降低等）或造血系统（粒细胞减少、贫血、紫癜等），亦可引起肝、肾功能障碍等。

(3) 变态反应 (allergy reaction)：又称过敏反应，是指少数病人由于体质特异，对某些药物所产生的病理性免疫反应。这种反应的产生与药物剂量无关。致敏原可以是药物本身，或其代谢产物，也可以是制剂中的杂质。不同药物有时可出现相类似的反应，轻者表现为药热、皮疹、血管神经性水肿等，重者可能引起过敏性休克甚至造成死亡。故对于易引起变态反应的药物，用药前应详细询问病人有无过敏史，进行过敏性试验，并做好解救的准备。

(4) 继发性反应 (secondary reaction)：是继发于药物治疗作用的不良反应，故又称治疗矛盾。如人肠道内有许多细菌寄生，这些菌群间相互制约，维持着平衡的共生状态。若长期应用广谱抗生素时，许多敏感菌株被抑制，使肠内菌群间相对平衡被打破，以至一些不敏感菌大量繁殖，引起继发性感染（二重感染）。

(5) 后遗效应 (residual effect)：指停药后血浆药物浓度已降到最低有效浓度以下仍残存的生物效应。如服用巴比妥类催眠药后次晨的思睡现象，长期使用糖皮质激素后的肾上腺皮质萎缩等。少数药物可引起持久的器质性损害，如某些氨基糖苷类抗生素引起的永久性耳聋。

(6) “三致”作用：是指致突变、致畸形及致癌作用。有的药物在应用过程中，可引起机体内DNA碱基对排列顺序发生改变（基因突变），称为致突变。有的药物可导致恶性肿瘤的发生，称为致癌。还有些药物可导致胚胎发育畸形，称为致畸。三者之间存有一定关系，在某些情况下并不能严格区分。

#### (四) 药物的量-效关系

药物的效应与剂量密切相关。研究表明，在一定的剂量范围内，药物剂量的大小与血中药物浓度的高低成正比，也与药物效应的强弱成正相关。这种剂量效应的关系即量-效关系。药物的剂量太小，可能不引起任何效应，只有剂量达到一定数值时才开始出现效应。刚刚引起效应的剂量称最小有效量（阈剂量）。随着剂量的增加，效应增强。能引起最大效应而不引起中毒的剂量称最大治疗量（极量）。大于极量，刚刚引起轻度中毒的剂量称最小中毒量。剂量继续增加，中毒逐渐加剧，引起死亡的剂量称致死量。临床应用的剂量通常大于最小有效量，而远远小于最小中毒量，且不超过极量。最小有效量与最小中毒量之间的范围称为“安全范围”。该范围越大，用药越安全，这个范围越小，即最小有效量和最小中毒量相距越近，用药越不安全（图2-1）。

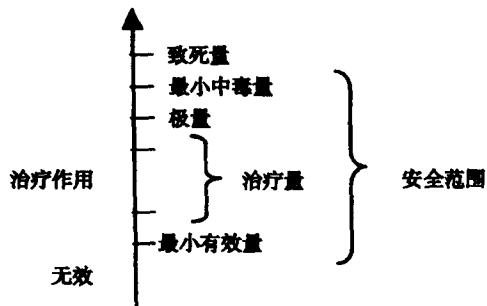


图2-1 药物剂量与效应的关系

以药物剂量或浓度为横坐标，药物效应或其百分率为纵坐标作图，可得量-效曲线，量效曲线一般为长尾S形（图2-2）。

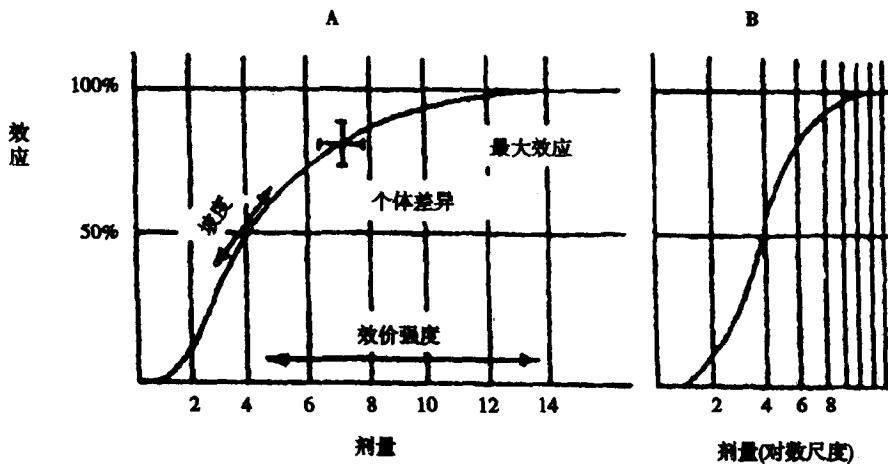


图2-2 药物量-效曲线