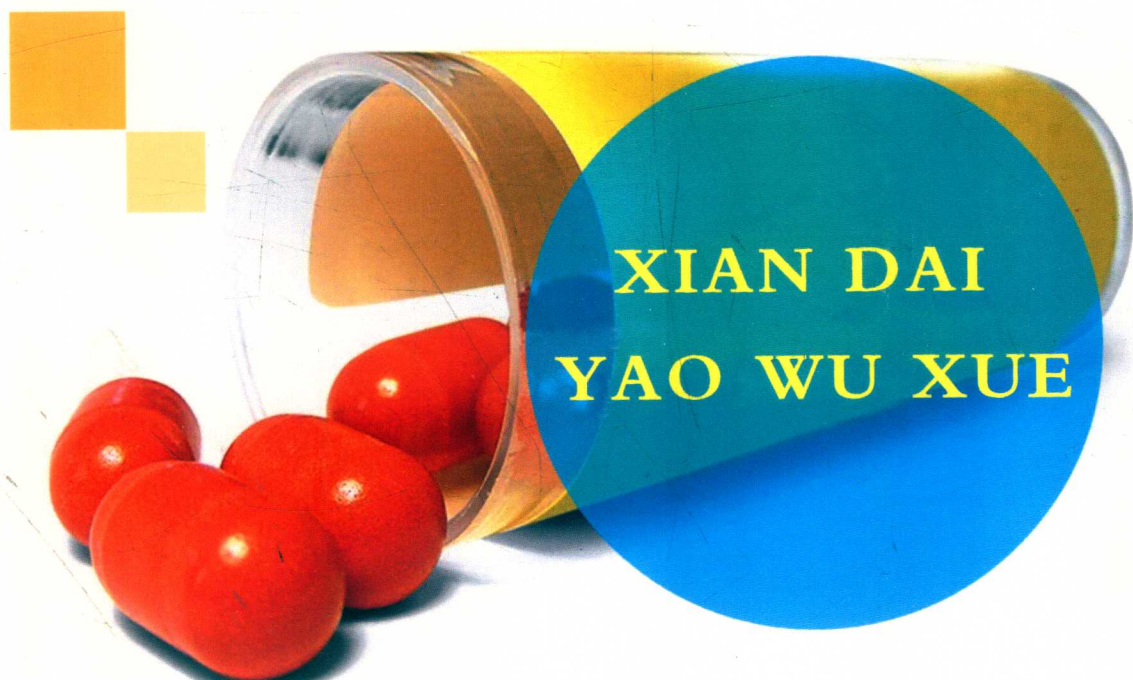


现代药理学

XIAN DAI YAO WU XUE

刘克令 等 主编



科学技术文献出版社
SCIENTIFIC AND TECHNICAL DOCUMENTATION PRESS

现代药理学

XIAN DAI YAO WU XUE

刘克令 等 主编



科学技术文献出版社
SCIENTIFIC AND TECHNICAL DOCUMENTATION PRESS

· 北 京 ·

图书在版编目（CIP）数据

现代药理学 / 刘克令等主编. —北京：科学技术文献出版社，2017.5
ISBN 978-7-5189-2746-3

I . ①现… II . ①刘… III . ①药理学 IV . ① R9

中国版本图书馆 CIP 数据核字（2017）第 122935 号

现代药理学

策划编辑：宫宇婷 责任编辑：杜新杰 宫宇婷 责任校对：赵 瑗 责任出版：张志平

出 版 者 科学技术文献出版社
地 址 北京市复兴路15号 邮编 100038
编 务 部 (010) 58882938, 58882087 (传真)
发 行 部 (010) 58882868, 58882874 (传真)
邮 购 部 (010) 58882873
官 方 网 址 www.stdp.com.cn
发 行 者 科学技术文献出版社发行 全国各地新华书店经销
印 刷 者 北京虎彩文化传播有限公司
版 次 2018 年 6 月第 1 版 2018 年 6 月第 1 次印刷
开 本 889×1194 1/16
字 数 908千
印 张 28.5
书 号 ISBN 978-7-5189-2746-3
定 价 128.00元



版权所有 违法必究
购买本社图书，凡字迹不清、缺页、倒页、脱页者，本社发行部负责调换

主 编

刘克令 徐 彬 殷津津 张海龙

副主编（按姓氏笔画排序）

申献玲 刘虎军 孙金山 李永霞

陈 敏 程华尧 潘瑞敏

编 委（按姓氏笔画排序）

申献玲（湖北省荆州市第一人民医院）

刘克令（山东省青岛市平度人民医院）

刘虎军（延安大学附属医院）

孙金山（甘肃省天祝县人民医院）

李永霞（山东大学齐鲁儿童医院）

吴丽娟（乌鲁木齐市头屯河区中心医院）

张海龙（驻马店市中心医院）

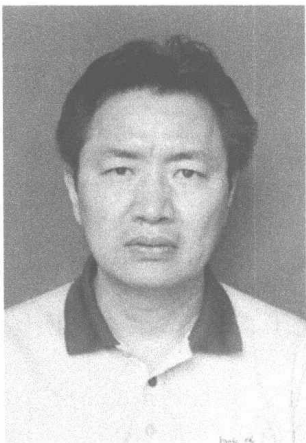
陈 敏（湖北医药学院附属随州医院）

徐 彬（山东省东营市广饶县疾病预防控制中心）

殷津津（山东省青岛市城阳区惜福镇街道卫生院）

程华尧（海南省妇幼保健院）

潘瑞敏（湖北医药学院附属随州医院）



刘克令

男，副主任药师，2000年毕业于山东省中医药大学。2004年起任平度市人民医院药剂科副主任，从事中西药品的管理工作十余年，对各种药品的管理、发放、使用，有丰富的实践经验；2016年起任平度市人民医院物资供应科主任，在各种物资的招标采购方面精益求精，特别是在严格执行全部药品在山东省药品集中采购平台挂网采购方面经验丰富，既保证了药品质量和供应，又尝试二次议价，大大降低了采购价格。在全国和省级刊物发表论文多篇：《医药》杂志全文收录的“医院静脉药物配置中心退药现状及分析”和“复方丹参注射液对二型糖尿病患者血管内皮血管的临床影响分析”，《光明中医》收录的“自发性气胸的病因及发病机制”，《河南中医》收录的“浅谈中药煎器、煎法、服法与临床的关系”等等。



徐彬

男，汉族，1963年出生。毕业于泰山医学院药学专业。现为山东省东营市广饶县疾病预防控制中心主管药师。近年在多家省级和国家级期刊上发表多篇学术论文。擅长研究抗菌药物的临床安全合理用药及不良反应。



殷津津

女，1985年7月出生，青岛市城阳区惜福镇街道卫生院副院长、主管药师，烟台大学药学院药学学士、青岛大学医学院药理学硕士，青岛市城阳区第六届人大代表。工作以来从事临床药学研究、药事管理、基层卫生管理等，具有扎实的理论基础和管理经验。从事的研究有靛红的抗菌作用；LPS、TNF- α 、IL-1 β 等对RAW264.7细胞的刺激作用；七叶皂苷钠防治术后肠粘连等，有多篇论文在国家级及省级期刊上发表。



张海龙

男，1983年3月出生，河南省遂平县人。主管药师，执业药师，临床药师。2010年毕业于河南中医学院药物分析专业，硕士研究生学历，毕业后工作于驻马店市中心医院，从事临床药学工作至今，2014—2015年于国家临床药师培训基地完成任务；先后在国家核心期刊发表论文多篇，对内分泌药物、心脑血管药物、抗菌药物、中成药物的临床应用颇有心得。

前言

药物学是临床重要的组成部分。药物是防治临床疾病的主要手段之一,与基础药理学、药学和临床应用的关系极为密切。人们生活在各种生物、物理因素、化学物质的环境中,新的疾病不断发生,很多疾病也未能彻底治愈。社会经济日益发展,人们对健康的要求更加迫切,期待着新的药物出现。希望这本书能为读者提供丰富的医药学知识,为我国的医药卫生事业做出应有的贡献。

本书共二十章,内容主要介绍了现代药理学的基础知识、基础理论和临床常用系统疾病药物,包括药理学基础、临床常用剂型、药物安全性及处置、药品和处方管理规定等。全书结构严谨、层次分明、结合临床用药中的实际问题,是临床药理学中不错的参考用书。

尽管我们对本书精心编写、认真审核,努力让读者满意,但由于编写时间仓促及水平所限,错误和疏漏在所难免,恳请广大读者予以指正和见谅,以便进一步修改完善。

《现代药理学》编委会

2017年2月

目 录

第一章 概 述.....	(1)
第二章 药物治疗的药理学基础.....	(5)
第三章 药物药效动力学	(14)
第一节 药物对机体的作用效应	(14)
第二节 受体与药物效应	(22)
第三节 中药药效学	(28)
第四章 药物代谢动力学	(40)
第一节 药物的体内过程	(40)
第二节 体内药量变化的时间过程	(46)
第三节 中药药动学研究	(51)
第五章 中药药理学	(65)
第一节 概 述	(65)
第二节 中药药理研究方法	(68)
第三节 中药毒理学	(87)
第六章 影响药物作用的因素	(99)
第一节 概 述	(99)
第二节 药物方面的因素	(99)
第三节 机体方面的因素.....	(101)
第四节 环境条件方面的因素.....	(104)

第七章 临床常用剂型..... (106)

第一节 概 述..... (106)

第二节 丸剂、滴丸剂和微丸 (109)

第三节 液体制剂..... (115)

第四节 软膏剂、乳膏剂与凝胶剂 (134)

第五节 临床新剂型..... (139)

第八章 药物安全性及处置..... (151)

第一节 药物不良反应..... (151)

第二节 药品不良反应的监测..... (155)

第三节 药物变态反应的防治与护理..... (157)

第四节 输液反应的防治与护理..... (158)

第五节 药物中毒的防治与护理..... (159)

第九章 合理使用药物..... (161)

第十章 特殊人群用药安全..... (174)

第十一章 药品和处方管理规定..... (185)

第十二章 中 药..... (187)

第一节 清热泻火药..... (187)

第二节 清热凉血药..... (194)

第三节 清热燥湿药..... (202)

第四节 利湿退黄药..... (211)

第十三章 抗生素..... (216)

第一节 概 论..... (216)

第二节 青霉素类..... (217)

第三节 头孢菌素类..... (226)

第四节 β -内酰胺酶抑制剂 (240)

第五节 碳青霉烯类和其他 β -内酰胺类 (244)

第六节 氨基苷类..... (249)

第七节 四环素类..... (255)

第八节	酰胺醇类·····	(258)
第九节	大环内酯类·····	(260)
第十节	糖肽类·····	(266)
第十一节	其他抗菌抗生素·····	(269)
第十四章	消化系统药物·····	(276)
第一节	助消化药·····	(276)
第二节	促胃肠动力药·····	(277)
第三节	止吐药及催吐药·····	(280)
第四节	泻药及止泻药·····	(284)
第五节	利胆药·····	(288)
第十五章	中枢神经系统药物·····	(291)
第一节	镇静、催眠、抗惊厥药·····	(291)
第二节	抗癫痫药·····	(295)
第三节	精神病用药·····	(301)
第十六章	呼吸系统药物·····	(326)
第一节	祛痰药·····	(326)
第二节	镇咳药·····	(331)
第三节	平喘药·····	(338)
第十七章	心血管系统药物·····	(355)
第一节	强心药·····	(355)
第二节	抗心律失常药·····	(358)
第三节	降血压药·····	(364)
第四节	抗心绞痛药·····	(372)
第五节	调节血脂药·····	(379)
第六节	抗动脉粥样硬化药·····	(381)
第七节	作用于心血管系统的中药·····	(383)
第十八章	内分泌系统药物·····	(415)
第一节	肾上腺皮质激素药·····	(415)

第二节 甲状腺激素药与抗甲状腺药..... (421)

第三节 胰岛素和口服降糖药..... (427)

第十九章 泌尿系统药物..... (432)

第一节 利尿药..... (432)

第二节 脱水药..... (435)

第二十章 消毒防腐药物..... (438)

参考文献..... (442)

第一章

概述

药理学是一门综合性学科。它包含药学许多方面的内容,并且与一些专门学科如药物治疗学、药理学、药剂学、药物化学等在内容上有一定程度的交叉,因此它涉足的领域具有相当的广度,但深度往往不如各有关专门学科。尽管如此,药理学仍是一门实用性很强的学科,也在与时俱进和不断提高。虽然现在各级医药院校一般都没有开设药理学课程,但药理学类的书籍却大量出版,而且历久不衰,特别是本书长期出版,经历了 60 年之久,这表明作为信息,药理学仍具有强大的生命力,它拥有广大的医药专业读者,在获取基本医药知识、提高医疗和用药水平上发挥着不容忽视的作用。其所以能如此,是由于它的内容实用性强,能指导医疗、药学等方面的实际工作,适合广大医药人员学习、参考的需要。

一、我国药物学史

药理学是一门古老的学科,在西方是如此,在我国也是如此。

我华夏之邦素称文明古国,向来以历史悠久、文化发达著称于世。我国医药起源很早,古代典籍有“伏羲氏尝味百草”“神农尝百草”之说,虽然伏羲、神农是否实有其人尚待确定,但肯定有人将前人的发现、经验进行归纳、总结和提高。这也表明我国早在原始社会,人们通过长期的生产、生活实践,已逐渐认识了某些植物、动物、矿物药的治疗作用。

根据现有史料,远在公元前 11 世纪以前的夏代和商代,我国就已有了酒和汤液的发明。周代的《诗经》《山海经》等著作中已收载许多种药物。长沙马王堆三号汉墓出土帛书《五十二病方》(据考证是公元前 3 世纪的写本)记载的药物达 242 种。秦汉之际,新的药物品种更不断增加。西汉初年已有药物著作在民间流传。汉平帝元始 5 年(公元 5 年)曾征集天下通晓方术本草者来京师,“本草”已成为药理学的通称。《神农本草经》约成书于公元 1~2 世纪间。它总结了东汉以前的药物知识,是我国现存最早的药物学专著,收载药物 365 种。以后许多朝代都曾编修过本草。南北朝时陶弘景将《神农本草经》加以整理补充,汇编成《本草经集注》,药物由 365 种增加到 730 种,这是《神农本草经》以后药理学的又一次整理提高。显庆 2 年(公元 657 年)唐政府组织长孙无忌、苏敬等 20 余人编撰本草,并向各地征集药物标本,绘制成图,于显庆 4 年编成,收载药物 850 种,取名《新修本草》。这是我国第一部由国家颁行的药理学权威著作,有人认为它是世界上最早的一部国家药典。宋代官方与私人均从事本草的编修。宋初,政府曾组织编修《开宝本草》《嘉祐本草》和《图经本草》,并颁行全国。四川名医唐慎微独力编成《经史证类备急本草》(简称《证类本草》),收载药物达 1558 种,附单方验方 3000 余首,为保存我国古代本草史料做出了贡献。明代李时珍所编《本草纲目》,集历代本草之大成,收载药物 1892 种,附方 11000 余首,共有插图 1160 幅,内容非常丰富。1596 年出版以后,不仅在国内广为流传,而且还陆续译成德、日、英、法文等文字,传播海外,成为国际上研究药理学和生物学的宝贵参考资料。清代赵学敏编著《本草纲目拾遗》,收《本草纲目》未收载之药 700 余种,同时还博采国外及民间医药资料,内容很有参考价值。

鸦片战争(1840 年)以后,我国海禁大开,西方医药大量传入,从而于传统医药之外逐渐形成另一西方

医药体系。反映在药理学著作方面,既有传统本草著述(如吴其浚的《植物名实图考》、屠道和的《本草汇纂》)和中西结合的生药学如赵黄等的《现代本草——生药学》的编撰,又有单纯介绍西方药物的著译作品,如傅约翰(亦译为傅兰雅)的《西药大成》及洪士提反的译作《万国药方》等。

以后,药理学著作的编撰出版逐渐增多,至新中国建立以前,陆续出版的有戴虹溥的《新体实用药理学》、梁心的《新纂药理学》、吴建瀛的《实用药理学》、顾学裘的《现代药理学》等,对普及西方药物知识起了有益作用。新中国成立以后,特别是改革开放之后,药理学书籍更如雨后春笋和百花争艳般地大量呈现。有的内容丰富,各具特色,对我国医药事业的发展起到重要的作用。

二、药物的来源及植物药的成分

(一)药物的来源

来源有二:一是自然界,二是人工制备(包括仿生药物)。来自自然界的药物为天然药物,包括中药及部分西药;来自人工制备的药物为化学药物,包括大部分西药。

天然药物,特别是中药,大都已经过长时期的临床使用,其疗效多已肯定,使用安全性较高,因此近年来受到各国医药界的重视。相比之下,化学药物则由于某些品种不良反应较大,有的不良反应还需要较长期使用后始能发现,其潜在的不安全性使人们转而注意天然药物。但习惯上认为中药较为安全的看法也被近来发生的某些“木通”类的肾毒性所改变。

植物性天然药物(植物药)在天然药物(包括中药)中占较大比例,它的化学成分一直受到人们的注意。经过近百年来研究,其成分现已大体为人们所了解。

(二)较重要的植物药化学成分

1.生物碱(甾碱)

其是一类含氮的碱性有机物质,大多数是无色或白色的结晶性粉末或细小结晶,味苦,少数是液体如槟榔碱)或有颜色(如小檗碱)。在水内多数难溶,比较易溶于有机溶剂如醚、氯仿、醇等(但与酸化合成盐后,就易溶于水,能溶或稍溶于醇,而难溶于醚、氯仿等)。这类成分一般都具有相当强烈的生理作用。重要的生物碱如:吗啡、可待因(含于阿片)、奎宁(含于金鸡纳皮)、咖啡因(含于茶叶、咖啡豆)、阿托品(含于颠茄等)、东莨菪碱(含于洋金花)、土的宁(含于番木鳖)、吐根碱(含于吐根)、麻黄碱(含于麻黄)、可卡因(含于古柯叶)、毒扁豆碱(含于毒扁豆)、毛果芸香碱(含于毛果芸香叶)、麦角新碱、麦角胺(含于麦角)、小檗碱(含于黄连、黄柏、三颗针等)、延胡索乙素(含于延胡索)、汉防己甲素、含于粉防己)等。

2.多聚糖

多聚糖简称多糖,是由十个以上的单糖基通过苷键连接而成的,一般多聚糖常由几百甚至几千个单糖组成。许多中草药中含有的多糖具有免疫促进作用,如黄芪多糖。从香菇分离出的香菇多糖具有明显的抑制实验动物肿瘤生长的作用。鹿茸多糖则可抗溃疡。

3.苷(配糖体;糖杂体)

其是糖或糖的衍生物与另一称为苷元(甙元或配基)的非糖物质,通过糖端的碳原子连接而成的化合物。苷的共性在糖的部分,而苷元部分几乎包罗各种类型的天然成分,故其性质各异。苷大多数是无色无臭的结晶或粉末,味苦或无味;多能溶于水与稀醇,亦能溶于其他溶剂;遇湿气及酶或酸、碱时即能被分解,生成苷元和糖。苷类可根据苷键原子不同而分为氧苷、硫苷、氮苷和碳苷,其中氧苷为最常见。

氧苷以苷元不同,又可分为醇苷、酚苷、氰苷、酯苷、吲哚苷等,现简述如下。

(1)醇苷:如具有适应原样作用的红景天苷和具有解痉止痛作用的獐牙菜苦苷均属醇苷。醇苷苷元中不少属于萜类和甾醇类化合物,其中强心苷和皂苷是重要的类型。含有强心苷的药物有洋地黄、羊角拗、夹竹桃、铃兰等。皂苷是一类比较复杂的苷类化合物,广泛存在于植物界,它大多可以溶于水,振摇后可生成胶体溶液,并具有持久性、似肥皂溶液的泡沫。皂苷是由皂苷元和糖、糖醛酸或其他有机酸所组成。按

照皂苷被水解后所生成的苷元的结构,皂苷可分为两大类:甾体皂苷和三萜皂苷。薯蓣科薯蓣属许多植物所含的薯蓣皂苷元属于甾体皂苷;三萜皂苷在自然界的分布也很广泛,种类很多,如桔梗、人参、三七、甘草、远志、柴胡等均含有三萜皂苷。

(2) 酚苷:黄酮、蒽醌类化合物通过酚羟基而形成黄酮苷、蒽醌苷。如芦丁、橙皮苷均属黄酮苷,分解后可产生具有药理活性的黄酮;大黄、芦荟、白番泻叶等含有蒽醌苷,分解后产生的蒽醌具有导泻作用。

(3) 氰苷:氰苷易水解而产生羟腈,后者很不稳定,可迅速分解为醛和氢氰酸。如苦杏仁苷属于芳香族氰苷,分解所释出的少量氢氰酸具有镇咳作用。

(4) 酯苷:如土槿皮中的抗真菌成分属酯苷。

(5) 吡啶苷:如中药所含的靛苷是一种吡啶苷,其苷元吡啶醇氧化成靛蓝,具有抗病毒作用。

4. 黄酮

其为广泛存在于植物界中的一类黄色素,大都与糖类结合为苷状结构存在。多具有降血脂、扩张冠脉、止血、镇咳、祛痰、减低血管脆性等作用。银杏、毛冬青、黄芩、陈皮、枳实、紫菀、满山红、紫花杜鹃、小叶枇杷、芫花、槐米、蒲黄等都含有此成分。

5. 内酯和香豆素(精)

内酯属含氧的杂环化合物。香豆素系邻羟基桂皮酸的内酯,为内酯中的一大类,单独存在或与糖结合成苷,可有镇咳、祛痰、平喘、抑菌、扩张冠脉、抗辐射等作用,含存于秦皮、矮地茶、补骨脂、蛇床子、白芷、前胡等。其他内酯含存于穿心莲、白头翁、当归、银杏叶等,具有各自的特殊作用。

6. 甾醇

其常与油脂类共存于种子和花粉粒中,也可能与糖结合成苷。 β -谷甾醇(黄柏、黄芩、人参、附子、天门冬、铁包金等含有)、豆甾醇(柴胡、汉防己、人参、款冬、黄柏等含有)、麦角甾醇(麦角、灵芝、猪苓等含有)及胆甾醇(即胆固醇,含于牛黄、蟾酥等)都属本类成分。

7. 木脂素

其多存在于植物的木部和树脂中,因此而得名。多数为游离状态,也有一些结合成苷。五味子、细辛、红花、连翘、牛蒡子含此成分。

8. 萜类

其为具有 $(C_5H_8)_n$ 通式的化合物以及其含氧与饱和程度不等的衍生物。中草药的一些挥发油、树脂、苦味素、色素等成分,大多属于萜类或含有萜类成分。

9. 挥发油(精油)

挥发油是一类混合物,其中常含数种乃至十数种化合物,主要成分是萜类及其含氧衍生物,具有挥发性,大多是无色或微黄色透明液体,具有特殊的香味,多比水轻,在水内稍溶或不溶,能溶于醇、醚等。其主要用途是调味、祛风、防腐、镇痛、通经、祛痰、镇咳、平喘等。含挥发油的中药很多,如:陈皮、丁香、薄荷、茴香、八角茴香、桂皮、豆蔻、姜、桉叶、细辛、白芷、当归、川芎、芸香草等。

10. 树脂

其均为混合物,主要的组成成分是二萜和三萜类衍生物,有的还包括木脂素类。多由挥发油经化学变化后生成,不溶于水,能溶于醇及醚。如松香就是一种树脂。树脂溶解于挥发油,即为“油树脂”。油树脂内如含有芳香酸(如苯甲酸、桂皮酸等),则称为“香胶”或“树香”,也称作“香树脂”。

11. 树胶

其是由树干渗出的一种固胶体,为糖类的衍生物。能溶于水,但不溶于醇,例如阿拉伯胶、西黄芪胶等。

12. 鞣质

从音译又名“单宁”。中药中含此成分较多的是五倍子、茶、大黄、石榴皮,其他树皮、叶、果实也常含有。鞣质多具收敛涩味,遇三氯化铁液变黑色,遇蛋白质、胶质、生物碱等能起沉淀,氧化后变为赤色或褐色。常见的五倍子鞣质亦称鞣酸,用酸水解时,分解出糖与五倍子酸,因此也可看作是苷。临床上用于止

血和解毒。

13. 有机酸

本成分广泛存在于植物中,未熟的果实内尤多,往往和钙、钾等结合成盐,常见的有枸橼酸、苹果酸、蚁酸、乳酸、琥珀酸、酒石酸、草酸、鞣栗酸等。

(徐 彬)

第二章

药物治疗的药理学基础

药物之所以能用于预防、治疗或诊断疾病,就在于药物与机体接触后,药物与机体之间可相互作用而产生特定的影响,它包括药物对机体(含病原体)的作用和机体对药物的作用;前者在药理学上属于药效学的范围,后者属于药物代谢动力学的范围。因此药物与机体的相互作用就成为药物治疗的药理学基础。

一、药物的作用和药效学及其基本概念

(一)药物对机体(含病原体)的作用

主要是对生理功能的兴奋或抑制。有些药物可使人体原有的生理功能加强,称为“兴奋”,如戊四氮可兴奋被抑制的呼吸中枢;有些则使生理功能减弱,称为“抑制”,如阿托品可使痉挛的胃肠平滑肌松弛。在人体内,同一药物对不同的器官可以产生不同的作用,例如肾上腺素对心脏呈兴奋作用,而对支气管平滑肌呈抑制作用(使其松弛)。由于药物剂量的增减,兴奋和抑制也可互相转化,例如戊四氮在治疗剂量时兴奋呼吸中枢,剂量过大时则引起阵挛性惊厥,并进一步转化为中枢抑制。

药物对病原体的作用,则主要是通过干扰病原体的代谢而抑制其生长繁殖,例如:青霉素抑制细菌细胞壁的合成;氯霉素抑制细菌核蛋白体的合成;氯喹同疟原虫的核蛋白结合(主要是与脱氧核糖核酸即DNA相结合)而抑制DNA的复制,使核酸合成减少,从而影响其生长繁殖。

(二)选择性作用

一种药物对于机体各器官组织的作用并不是一样的,往往是对某一个或几个器官组织的某些功能影响特别明显,而对其他器官组织的影响则并不突出。这就是药物的选择作用。例如洋地黄之对于心脏,苯巴比妥之对于中枢神经系统,都具有选择作用。但选择作用一般说来是相对的,而非绝对的,也就是说,一种药物往往同时对几个组织或器官的功能都产生影响,只不过其作用强度有量的区别而已。一种药物只有一种作用的情况是很少见的。选择性高的药物,往往不良反应较少、疗效较好,临床应用可以有针对性地治疗某种疾病。有些药物小剂量时只选择作用于个别器官,大剂量时则引起较广泛的全身性毒性反应,故应注意剂量的掌握。

(三)局部作用和吸收作用

药物应用于机体时,根据其作用部位的不同,可分为局部作用和吸收作用。前者系指药物在用药部位所呈现的作用(如普鲁卡因的局部麻醉作用),后者则指药物被机体吸收以后所呈现的作用(如服氯喹后出现的抗疟作用)。

(四)药物与受体的相互作用

多年以前,有人就曾提出,药物所以能够发生作用,是由于它与机体效应器的某一部位相结合,这一部

位当时被称为“接受物质”，以后又被称为“受体”(receptor)或“受点”(receptor site)。现已确知，“受体”是位于细胞膜或细胞内的一种蛋白质，能同体内神经传导介质、激素及其他内源性活性物质或某些药物相结合，从而引起一系列生化反应，表现为细胞或组织器官功能的兴奋或抑制。受体有高度的特异性。如和乙酰胆碱结合的受体，称为“胆碱受体”。受体还可有其亚型，如胆碱受体分成毒蕈碱型(M)和烟碱型(N)两类。前者可以分为 M_1 、 M_2 、 M_3 、 M_4 、 M_5 等类；后者又分为两型：1型(N_1 ，又称 N_N 型)和2型(N_2 ，又称 N_M 型)。

已知的受体有胆碱受体、肾上腺素受体、多巴胺受体、5-羟色胺受体、吗啡受体(阿片受体)、组胺受体(包括组胺 H_1 受体和 H_2 受体)，以及各种激素(如肾上腺皮质激素、性激素、胰岛素等)的受体等。

当然，并不是所有药物都是通过与受体结合而产生作用的，例如某些吸入性全身麻醉药，它们产生麻醉作用，据认为就不是通过与特殊受体的结合，而可能是由于它们易溶于类脂质，能浓集于富含脂质的神经组织，使神经细胞膜的通透性发生变化，从而引起神经冲动传导障碍。

既具有与受体结合的亲和力，又具有内在活性的药物，可以与相应的受体结合，并激动受体，继而产生一定的生物效应(如心脏收缩、腺体分泌等)，这类药物称为受体激动剂(agonist)，如乙酰胆碱，可与胆碱受体结合并使其激动。只具有与受体结合的亲和力，但不具有内在活性的药物，可以与相应的受体结合，但不能激动受体，甚至可以阻滞激动剂与之结合而发生效应，这类药物称为受体拮抗剂(antagonist)或阻滞剂，如阿托品，可以与胆碱受体结合而阻断乙酰胆碱与之结合从而拮抗乙酰胆碱的效应。

药物与受体结合后，通过信号传导系统引起细胞的反应，这是一种重要的药物作用机制。

细胞膜上受体的数目或反应性可受其周围的生物活性物质或药物(激动剂或拮抗剂)的作用或浓度的影响而发生改变。上述药物或药物浓度高、作用过强或长期激动受体，可使受体数目减少，称为衰减性或向下性调节。反之，可使受体数目增多，称为上增性或向上调节。向下调节与机体对长期应用激动剂或产生耐受性有关，如哮喘患者久用异丙肾肾上腺素治疗可以产生疗效降低；而向上调节则与长期应用拮抗剂后敏感性增加或撤药症状有关，如高血压患者应用普萘洛尔时突然停药可引起反跳现象。

二、药物的体内过程和药物代谢动力学及其基本概念

(一)药物的体内过程

药物进入机体后，药物在机体的影响下，可以发生一系列的运动和体内过程：如药物自用药部位被吸收进入(静脉注射则直接进入)血液循环；然后分布于各器官组织、组织间隙或细胞内；有些药物则在血浆、组织中与蛋白质结合；或在各组织(主要是肝脏)发生化学反应而被代谢；最后，药物可通过各种途径离开机体(排泄)；即药物的吸收、分布、代谢和排泄过程。它们可归纳为两大方面：一是药物在体内位置的变化，即药物的转运，如吸收、分布、排泄；二是药物的化学结构的改变，即药物的转化(又称生物转化)，亦即狭义的代谢。由于转运和转化以致引起药物在体内量或浓度(血浆内、组织内)的变化，而且这一变化可随用药后的时间移行而发生动态变化。众所周知，药物对机体的作用或效应是依赖于药物的体内浓度，因而上述各过程对于药物的作用也就具有重要的意义。

1.药物的吸收

药物的吸收是它从用药部位转运至血液的过程。其吸收快、慢、难、易，可受多种因素的影响。

(1)药物本身的理化性质：脂溶性物质因可溶于生物膜的类脂质中而扩散，故较易吸收；小分子的水溶性物质可自由通过生物膜的膜孔扩散从而被吸收；而如硫酸钡，它既不溶于水又不溶于脂肪，虽大量口服也不致引起吸收中毒，故可用于胃肠造影。非解离型药物可被转运，故酸性有机药物如水杨酸类、巴比妥类，在酸性的胃液中不离解，呈脂溶性，故在胃中易于吸收。而碱性有机药物如生物碱类，在胃液中大部分离解，故难以吸收，到肠内碱性环境中才被吸收。改变吸收部位环境的 pH，使脂溶性药物不离解部分的浓度提高时，吸收就会增加，例如用碳酸氢钠使胃液 pH 升高时，可使碱性药物在胃中的吸收增加，而酸性药物的吸收则减少。

(2) 给药的途径: 在组织不破损无炎症的情况下, 除静脉给药(直接进入血流)外, 吸收的快慢顺序如下: 肺泡(气雾吸入)—肌内或皮下注射—黏膜(包括口服、舌下给药)—皮肤给药。

(3) 药物浓度、吸收面积以及局部血流速度等: 一般地说, 药物浓度大, 吸收面积广, 局部血流快, 可使吸收加快。胃肠道淤血时, 药物吸收就会减慢。

2. 药物的分布

药物吸收入血后随血液循环向全身分布, 有的分布均匀, 有的分布并不均匀。有些药物对某些组织有特殊的亲和力, 例如碘浓集于甲状腺中; 氯喹在肝中浓度比血浆中浓度高约数百倍; 汞、镉、砷等以及类金属在肝、肾中沉积较多, 故在中毒时这些器官常首先受害。

药物分布至作用部位, 必须透过不同的屏障, 如毛细血管壁、血脑屏障、胎盘等。对于毛细血管壁, 脂溶性或水溶性小分子易于透过; 非脂溶性药物透过的速度与其分子大小成反比(大分子药物如右旋糖酐, 通过毛细血管很慢, 停留在血液中的时间较长, 故可作为血浆代用品); 解离型药物较难透过。对于血脑屏障, 水溶性化合物难以通过, 脂溶性物质如乙醚、氯仿等则易于通过。青霉素不易通过血脑屏障, 进入脑脊液的概率很小, 故用它治疗流脑时, 必须加大剂量, 才能保证脑脊液中有足够的浓度。对于胎盘, 非解离型的高脂溶性药物, 例如某些全身麻醉药、巴比妥类, 易于通过, 而高度离解或脂溶性低的药物, 如季铵类、右旋糖酐, 透过率则很低。妊娠期妇女用药时, 必须考虑药物会不会通过胎盘进入胎儿体内而造成不良后果。

影响药物分布的另一个因素是药物与血浆蛋白质结合的能力。有一些药物在血浆中有一部分与血浆蛋白结合, 有一部分则保持自由状态。保持自由状态的药物可以通过生物膜。例如磺胺嘧啶与血浆蛋白结合率低, 可分布到脑脊液中的量较多, 故在治疗流脑时是首选药物。

3. 药物的代谢

多数药物(并不是所有药物)在体内都要经过不同程度的结构变化——主要通过氧化、还原、分解、结合等方式进行。多数药物经过代谢, 其药理作用可被减弱或完全丧失。也有少数药物只有经过体内代谢才能发挥有效作用(例如环磷酰胺本身并无活性, 在体内经水解释出氮芥后才发挥抗肿瘤作用)。

药物代谢有赖于酶的催化, 体内有两类催化酶, 专一性的和非专一性的, 前者如单胺氧化酶(氧化单胺类药物), 后者主要为肝微粒体混合功能酶系统, 又称肝药酶或简称为 P_{450} , P_{450} 酶系是一个超家族, 其成员依次分为家族、亚家族和酶个体 3 级, 常以缩写来表示: P_{450} 的缩写为 CYP; 家族以阿拉伯数字表示; 亚家族以大写英文字母表示。大部分药物是被 CYP3A4 所代谢。此酶系统个体差异很大。此外, 某些药物(酶促剂)可增强 P_{450} 的活性; 也有些药物(酶抑制剂)可减弱 P_{450} 的活性, 它们在药物相互作用方面很重要。

体内主要的代谢场所在肝脏, 肝功能不全时, 药物代谢必然受到影响, 容易引起中毒。因此, 对肝功能不全的患者用药须特别注意选择药物, 并掌握适当剂量。

4. 药物的排泄

药物最后都要从机体排出。肾脏是药物排泄的主要途径。当肾功能不全、尿少或无尿时, 肾脏排泄药物的能力大大减弱, 因此必须酌减药物用量与给药次数。在给予具有显著毒性不良反应的药物时, 特别要注意患者的肾功能是否健全。

一般酸性药物在碱性尿中排泄较多, 碱性药物则在酸性尿中易于排出。这一规律可用于某些药物中毒的治疗。例如, 苯巴比妥是一弱酸, 给予碳酸氢钠使尿碱化, 即可使其排泄增加。水杨酸类如与碳酸氢钠同服, 其排泄亦可增加, 血药浓度则随之减低。故在治疗水杨酸类中毒时可给予碳酸氢钠, 但在治疗风湿性关节炎需要保持一定的血药浓度时, 则不宜与碳酸氢钠同服。氯化铵可使尿液酸化, 因而使碱性药物排泄增加。

各种药物排泄的快慢很不一致。一般说来, 水溶性药物比非水溶性药物排泄快, 挥发性药物比不挥发的药物排泄快。血浆中的青霉素排泄其一半量的时间(即半衰期)不超过 0.5 小时; 水杨酸钠、碘化钾等排泄则较慢; 溴化物以及某些重金属、类金属等排泄更慢, 在血浆中排泄其一半量需 1 周以上时间。

某些药物可根据其排泄速度, 如按其半衰期(又称“半寿期”, 指药物血浆浓度下降一半所需的时间),