



中国科学院教材建设专家委员会规划教材

全国高等医药院校规划教材

供预防、口腔、麻醉、影像、药学、中医、护理、全科医学、生物技术、检验等专业使用

药理学

主编 徐晓燕 王巧云 曲梅花



科学出版社

中国科学院教材建设专家委员会规划教材
全国高等医药院校规划教材

供预防、口腔、麻醉、影像、药学、中医、护理、
全科医学、生物技术、检验等专业使用

药 理 学

主 编 徐晓燕 王巧云 曲梅花

副主编 张秀荣 王垣芳 马 健

王学健 王超云 尹凤玲

编 者 (按姓氏笔画排序)

马 健 王 瑞 王 澄 王 琳

王巧云 王学健 王垣芳 王晓丹

王超云 尹凤玲 曲梅花 孙红柳

李庆忠 李淑翠 杨 茗 张世栋

张秀荣 陈 伟 陈美华 房春燕

赵廷坤 赵春贞 徐晓燕 高 山

科 学 出 版 社

北 京

内 容 简 介

本书按照药理学教学大纲的要求分章设计编写,涵盖了药理学本科教学大纲的全部内容。全书共分四十四章,突出了药理学基本理论和基本知识,以及常用药的药理作用、作用机制、临床应用、不良反应及重要的药代动力学知识、构效关系、药物相互作用和禁忌证等内容,体现了医学基础学科和临床学科的联系,并且有一定的综合性。教材合理优化教学内容,突出“必需、够用”的特色,避免不适用内容和重复内容、突出重点,增强实用性。在编写格式方面,每章设置“目标要求”、“知识链接”及“本章小结”。“目标要求”以简要文字强调该章的学习重点,引导学生学习;“知识链接”帮助学生启迪思维,拓展知识,更加突出实用性和新颖性,激发学生学习兴趣;“本章小结”总结概括每章的主要知识点,有助于学生复习巩固相关知识。

图书在版编目(CIP)数据

药理学 / 徐晓燕, 王巧云, 曲梅花主编. —北京: 科学出版社, 2016.8
中国科学院教材建设专家委员会规划教材·全国高等医药院校规划教材
ISBN 978-7-03-049600-3

I. ①药… II. ①徐… ②王… ③曲… III. ①药理学 - 医学院校 - 教材
IV. ① R96

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2016) 第 195413 号

责任编辑: 胡治国 / 责任校对: 李 颖

责任印制: 赵 博 / 封面设计: 陈 敬

版权所有, 违者必究。未经本社许可, 数字图书馆不得使用

科学出版社 出版

北京东黄城根北街 16 号

邮政编码: 100717

<http://www.sciencep.com>

三河市骏杰印刷有限公司印刷

科学出版社发行 各地新华书店经销

*

2016 年 8 月第 一 版 开本: 787 × 1092 1/16

2016 年 8 月第一次印刷 印张: 22

字数: 520 000

定价: 68.00 元

(如有印装质量问题, 我社负责调换)

前言

Preface

本教材认真贯彻教材“三基”（基本理论、基本知识、基本技能）、“五性”（思想性、科学性、先进性、启发性、适用性）和“三特定”（特定培养对象、特定目标要求、特定时间限制）的原则，力求顺应我国高等医学教育教学改革的发展趋势，注重体现素质教育、创新能力与实践能力的培养，为学生知识、能力、素质协调发展创造条件。可供预防、口腔、麻醉、影像、药学、中医、护理、全科医学、生物技术、检验等专业使用。

药理学主要研究和阐明药物与机体之间的相互作用及作用规律，为临床合理、安全、有效地应用药物提供理论依据，同时为药物研发及正确评价提供理论指导，是临床医学及相关专业的主干课程之一。全书共设44章，前4章为药理学总论部分，主要介绍了药理学基本概念、药效学、药动学基本理论及影响药物效应的主要因素；其余41章为各论部分，重点介绍各类药物的药动学、药理作用、作用机制、临床应用及不良反应等。

本教材涵盖药理学本科教学大纲的全部内容，同时合理优化教学内容，突出“必需、够用”的特色，避免不适用内容和重复内容、教材篇幅大幅精简。教材编写的主要特色为：每章前设有“目标要求”，明确学生要掌握的重点内容，引导学生学习；每章末设“本章小结”凝练要点，帮助学生复习巩固；正文中灵活插入“知识链接”，激发学生学习兴趣和主观能动性。

本教材在编写过程中借鉴和吸收了国内外多本《药理学》教材和参考书的精华，在此向本教材各参考文献的原作者们表示衷心感谢！

本教材由教学一线的药理学教师精诚合作编写而成，各位编者秉承了严谨求实的科学精神，为编好本书倾注了大量心血，在此一并表示诚挚的谢意！

由于我们的学识和水平有限，书中难免存在不足和疏漏，真诚的希望广大师生在使用本教材过程中多提宝贵意见，给予批评指正。

编者
2016年6月

目录 Contents

第一章 绪论	1
第一节 药理学的性质与任务	1
第二节 药理学发展简史	1
第三节 药理学学习方法	2
第四节 新药开发与研究	3
第二章 药物代谢动力学	5
第一节 药物分子的跨膜转运	5
第二节 药物的体内过程	6
第三节 房室模型	10
第四节 药物消除动力学	12
第五节 体内药物的时量关系	13
第六节 药物代谢动力学的重要参数	15
第七节 药物剂量的设计和优化	17
第三章 药物效应动力学	20
第一节 药物作用的基本规律	20
第二节 药物剂量与效应关系	23
第三节 药物的作用机制	27
第四章 影响药物作用的因素	32
第一节 药物因素	32
第二节 机体方面的因素	35
第五章 传出神经系统药理概论	38
第一节 传出神经系统的分类	38
第二节 传出神经系统的递质和受体	39
第三节 传出神经系统药物的作用方式及分类	43
第六章 胆碱受体激动药	45
第一节 M、N 胆碱受体激动药	45



第二节 M 胆碱受体激动药	46
第三节 N 胆碱受体激动药	48
第七章 抗胆碱酯酶药和胆碱酯酶复活药	50
第一节 抗胆碱酯酶药	50
第二节 胆碱酯酶复活药	53
第八章 胆碱受体阻断药	55
第一节 M 受体阻断药	55
第二节 N 受体阻断药	58
第九章 肾上腺素受体激动药	61
第一节 α 、 β 受体激动药	62
第二节 α 受体激动药	65
第三节 β 受体激动药	66
第十章 肾上腺素受体阻断药	69
第一节 α 受体阻断药	69
第二节 β 受体阻断药	71
第三节 α 、 β 受体阻断药	73
第十一章 全身麻醉药	75
第一节 吸入性麻醉药	75
第二节 静脉麻醉药	77
第三节 复合麻醉	78
第十二章 局部麻醉药	80
第一节 概述	80
第二节 临床常用局麻药	83
第十三章 镇静催眠药	85
第一节 苯二氮草类	86
第二节 巴比妥类	89
第三节 其他镇静催眠药	91
第十四章 抗癫痫药与抗惊厥药	93
第一节 抗癫痫药	93
第二节 抗癫痫药的用药原则	96
第三节 抗惊厥药	96

第十五章 治疗中枢神经退行性疾病的药物	98
第一节 抗帕金森病药	98
第二节 治疗阿尔茨海默病药	103
第十六章 抗精神失常药	106
第一节 抗精神病药	106
第二节 抗躁狂症药	110
第三节 抗抑郁症药	111
第四节 抗焦虑药	112
第十七章 镇痛药	114
第一节 概述	114
第二节 阿片生物碱类镇痛药	114
第三节 人工合成镇痛药	118
第四节 其他镇痛药	120
第五节 阿片受体拮抗剂	121
第十八章 解热镇痛抗炎药	122
第一节 概述	122
第二节 常用解热镇痛抗炎药	124
第三节 抗痛风药	129
第十九章 利尿药与脱水药	131
第一节 利尿药	131
第二节 脱水药	136
第二十章 抗心律失常药	138
第一节 心律失常发生的电生理学基础	138
第二节 抗心律失常药的基本作用机制及药物分类	141
第三节 常用抗心律失常药	142
第四节 抗心律失常药物的合理应用	145
第二十一章 抗高血压药	147
第一节 抗高血压药分类	148
第二节 常用抗高血压药	148
第三节 其他抗高血压药	153
第四节 抗高血压药的合理选用及应用原则	155



第二十二章 治疗心力衰竭的药物	157
第一节 肾素 - 血管紧张素 - 醛固酮系统抑制药	158
第二节 利尿药	159
第三节 β 受体阻断药	159
第四节 正性肌力作用药	160
第五节 血管扩张药	163
第二十三章 抗心绞痛药	165
第一节 常用抗心绞痛药	166
第二节 其他抗心绞痛药	169
第二十四章 调血脂药与抗动脉粥样硬化药	171
第一节 调血脂药	171
第二节 抗氧化剂	174
第三节 多烯脂肪酸类	175
第四节 黏多糖和多糖类	176
第二十五章 作用于呼吸系统的药物	177
第一节 平喘药	177
第二节 镇咳药	182
第三节 祛痰药	184
第二十六章 作用于消化系统的药物	186
第一节 抗消化性溃疡药	186
第二节 消化功能调节药	191
第三节 利胆药和胆石溶解药	196
第二十七章 作用于血液与造血系统的药物	198
第一节 抗凝血药	198
第二节 抗血小板药	201
第三节 纤维蛋白溶解药	202
第四节 促凝血药	203
第五节 抗贫血药	205
第六节 促白细胞生成药	207
第七节 血容量扩充药	207
第二十八章 子宫平滑肌收缩药与舒张药	209
第一节 子宫平滑肌收缩药	209

第二节 子宫平滑肌舒张药	212
第二十九章 组胺与组胺受体阻断药	213
第一节 组胺及组胺受体激动药	213
第二节 抗组胺药	215
第三十章 肾上腺皮质激素类药	219
第一节 糖皮质激素类药	220
第二节 盐皮质激素类药	228
第三节 促皮质素与皮质激素抑制药	228
第三十一章 甲状腺激素及抗甲状腺药	230
第一节 甲状腺激素类药	230
第二节 抗甲状腺药	233
第三十二章 胰岛素及口服降血糖药	238
第一节 胰岛素	238
第二节 口服降血糖药	242
第三十三章 性激素类药与抗生育药	248
第一节 雌激素类与抗雌激素类药	248
第二节 孕激素类药及抗孕激素类药	252
第三节 雄激素类药与抗雄激素类药	253
第四节 促性腺激素类药	255
第五节 抗生育药	255
第三十四章 抗菌药物概论	259
第一节 抗菌药物的常用术语	260
第二节 抗菌药物作用机制	261
第三节 细菌耐药性	262
第四节 抗菌药物合理应用原则	263
第三十五章 β -内酰胺类抗生素	267
第一节 概述	267
第二节 青霉素类	268
第三节 头孢菌素类	271
第四节 其他 β -内酰胺类	273
第三十六章 大环内酯类、林可霉素类及多肽类抗生素	276
第一节 大环内酯类抗生素	276



第二节 林可霉素类抗生素	279
第三节 多肽类抗生素	280
第三十七章 氨基糖苷类抗生素	282
第一节 氨基糖苷类抗生素的共性	282
第二节 常用的氨基糖苷类抗生素	285
第三十八章 四环素类和氯霉素类抗生素	288
第一节 四环素类	288
第二节 氯霉素类	292
第三十九章 人工合成抗菌药	294
第一节 喹诺酮类药	294
第二节 磺胺类药	297
第三节 其他合成抗菌药	299
第四十章 抗结核药	301
第一节 常用抗结核药	301
第二节 抗结核药的临床应用原则	304
第四十一章 抗真菌药和抗病毒药	306
第一节 抗真菌药	306
第二节 抗病毒药	309
第四十二章 抗寄生虫病药	313
第一节 抗疟药	313
第二节 抗阿米巴病药与抗滴虫病药	317
第三节 抗血吸虫病药和抗丝虫病药	318
第四节 抗肠蠕虫病药	319
第四十三章 抗恶性肿瘤药	321
第一节 抗恶性肿瘤药的药理作用基础	321
第二节 细胞毒类抗肿瘤药	322
第三节 非细胞毒类抗肿瘤药	329
第四节 细胞毒类抗肿瘤药的应用原则及毒性反应	333
第四十四章 影响免疫功能的药物	336
第一节 概述	336
第二节 免疫抑制药	337
第三节 免疫增强药	340



第一章 绪 论



目标要求

1. 掌握：药理学、药物、药效学及药动学的概念。
2. 熟悉：药理学的性质与任务；新药的开发与研究。
3. 了解：药理学发展简史及学习方法。

第一节 药理学的性质与任务

药理学 (pharmacology) 是研究药物与机体 (包括病原体) 间相互作用及其规律的学科。药物 (drug) 是指可以改变或查明机体的生理功能及病理状态, 用于预防、诊断和治疗疾病的化学物质。毒物 (toxicant) 指在较小剂量即对机体产生剧烈毒性作用, 损害人体健康的化学物质。药物和毒物之间并无严格界限, 任何药物剂量过大时都可产生毒性反应。

药理学主要研究内容包括两个方面, 一方面研究机体对药物的作用及规律, 包括药物的体内过程及药物在体内随时间而变化的动态规律, 称为药物代谢动力学 (pharmacokinetics, 简称药动学); 另一方面研究药物对机体的作用及机制, 包括药物的作用、临床应用和不良反应等, 称为药物效应动力学 (pharmacodynamics, 简称药效学)。

药理学的主要学科任务有 3 个: ①阐明药物的作用及其作用机制, 为临床合理用药、防治不良反应提供理论依据; ②研究开发新药, 发现老药新用途; ③探索生命现象的本质和揭示疾病发生发展的规律。

药理学以生命科学和化学的发展为依托, 沟通医学和药学的最新成就, 既是理论科学, 又是应用科学。药理学的方法是实验性的, 根据实验对象的不同, 药理学的实验方法大致分为三类: ①实验药理学方法: 以健康动物和正常器官、组织、细胞、亚细胞和受体分子为实验对象, 进行药效学和药动学的研究。②实验治疗学方法: 是以病理模型动物或组织器官为对象, 观察药物治疗作用的一种方法。③临床药理学方法: 以健康志愿者或病人为对象, 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, 促进新药开发, 推动药物治疗学发展, 确保合理用药。

第二节 药理学发展简史

从远古时代起, 人类在生活和生产实践中积累了丰富的药物方面知识和防病治病的经



验,其中有不少流传至今,例如饮酒止痛、大黄导泻、柳皮退热等,但对药物治疗疾病还缺乏科学的认识。药理学的建立和发展与现代科学技术的发展密切相关,大致分为三个阶段。

一、传统本草学阶段

古代的药物学著作称为本草学,是因为药物中植物类药占绝大部分。我国最早的药物学著作是《神农本草经》,著书于公元1世纪前后,共收载药物365种,并按其作用和毒性进行了分类,这也是世界最早的药物学著作之一。至唐代,标明专门本草的著作有20余种,其中《新修本草》记载药物884种,是我国乃至世界上第一部由政府颁发的药物法典。16世纪末,明代医药学家李时珍所著的《本草纲目》是一部世界闻名的药物学巨著。全书52卷,约190万字,收载药物1892种,其中植物类药1195种,动物类药340种,矿石类药357种,插图1160帧,药方11000余条。该书已被译成日、法、朝、德、英、俄、拉丁7种文本,成为世界性经典药物学文献。

二、近代药理学阶段

在18世纪,化学学科和生理学的迅速发展为药理学的发展奠定了科学基础。19世纪初,实验药理学的创立标志着近代药理学阶段的开始。

首先,化学的发展把植物药从成分复杂的粗制剂发展成为化学纯品。例如,德国药师F.W.Serturmer首先于1803年从罂粟中分离提纯吗啡,用犬进行实验,证明了其镇痛作用,随后土的宁、奎宁、阿托品等生物碱相继问世。其次,生理学的兴起对药理学发展发挥了重要作用。19世纪,生理学家建立了许多实验生理学的方法,并用来观察植物药和合成药对生理功能的影响。1819年,F.Magendie用青蛙实验确定了土的宁的作用部位在脊髓。这些工作为药理学创造了实验方法,此后诸如催眠药、解热镇痛药和局部麻醉药等大量被应用于临床。这期间,德国R.Buchheim建立了第一个药理实验室,使药理学真正成为一门独立的学科。

三、现代药理学阶段

现代药理学阶段大约从20世纪初开始。20世纪30~50年代是新药发展的黄金时代,现在临床上常用的几类药物,如磺胺类药物、抗生素、甾体激素、非甾体类抗炎药以及维生素类中许多药物均是在这一时期研制开发的。1909年,德国P. Ehrlich发现砷凡纳明可以治疗梅毒,开创了应用化学药物治疗传染病的新纪元;1940年,英国学者H. W. Florey在A. Fleming(1928年)研究的基础上提取出了青霉素,使化学治疗进入抗生素时代;20世纪中叶,自然科学技术的蓬勃发展为新药研究与开发提供了理论、技术和方法,使药理学研究从原来的系统、器官水平发展到细胞、亚细胞及分子水平,对药物作用机制的研究也逐步深入。

第三节 药理学的学习方法

1. 密切联系基础医学课程知识 有针对性地复习相关生理学、生物化学、病理学等基础医学知识,有助于理解和掌握药物作用和作用机制。

2. 掌握药物的特点 根据药物分类及代表药,掌握每类药物中代表药物的作用、临床应用和不良反应以及各类药物的共性,运用归纳比较法找出每个药物的特点加以记忆,并正

确选用药物。

3. 认识药物作用的双重性 全面掌握药物的治疗作用和不良反应，力求做到安全、合理用药，避免或减少药物不良反应的发生。

4. 重视实训 药理学实训不仅可以验证药理学理论，加深对理论知识的理解和掌握，而且能够强化动手能力，同时也能够培养观察事物和分析事物的能力，有助于科学精神和创新能力的培养。

第四节 新药开发与研究

新药是指未曾在中国境内上市销售的药品。已生产的药品改变剂型、改变给药途径、增加新的适应证或制成新的复方制剂，也按新药管理。新药研究和开发是非常严格而复杂的过程，是不断发现和提供安全、高效和适应疾病谱的新药的源泉。对保障人民健康和发展国民经济具有十分重要的意义。现代科学技术的进步推动了医药工业的发展，提高了新药研制水平，加快了新药开发速度。

新药研究可分临床前研究和临床研究。临床前研究除药学研究外，还要进行系统的动物实验研究及慢性毒性观察，同时要测定药物在动物体内的动态变化，并经药品管理部门的初步审批后才能进行临床研究。新药的临床研究一般分为4期，具体分期见表1-1。它是以正常和患病人体为研究对象，研究药物对人体的作用和作用规律，对新药的有效性、安全性做出初步评价，并推荐临床给药剂量。新药在经过临床试验后，方可批准生产、上市。

表 1-1 药物临床试验不同阶段及分期

分期	目的	对象	例数	
上市前Ⅰ	初步的临床药理学及人体安全性评价	观察人体对新药的耐受程度和药动学，为制订给药方案提供依据	健康 志愿者	20~30
上市前Ⅱ	治疗作用的初步评价	观察对患者的治疗作用 and 安全性，为Ⅲ期临床试验设计和给药方案确定提供依据	目标适应证 患者	100
上市前Ⅲ	扩大临床试验（批准试生产后）	进一步验证治疗作用 and 安全性，评价利益风险关系，最终为新药获批提供充分依据	目标适应证 患者	300
上市后Ⅳ	上市后药物临床再评价	考察药物在广泛使用条件下的疗效与不良反应	普通或 特殊人群	常见病 ≥ 2000 例



知识链接

0 期临床试验

0 期临床试验是一种先于传统的 I 期临床试验开展的研究,旨在评价受试药物的药效动力学和药动学特征。0 期试验的特点是:小剂量、短周期、少量受试者、不以药物疗效评价为目的。0 期试验主要用于作用靶点指标和(或)生物标记物的抗肿瘤候选药物的药效学和药动学评价。开展 0 期临床研究可参考美国食品和药品监督管理局的《探索性研究药物指南》。0 期临床试验的局限性可以通过良好的试验设计加以克服,对于分子靶向的抗肿瘤药物,0 期临床研究可提高研究的效率和后续研究的成功率。



本章小结

药理学是研究药物与机体间相互作用及其规律的学科。药物效应动力学和药物代谢动力学是其主要研究内容。药理学的学科任务是要为阐明药物作用机制、改善药物质量、提高药物疗效、开发新药、发现药物新用途并为探索细胞生理生化及病理过程提供实验资料。学习目的是在疾病的防治过程中更好地发挥药物作用而减少其不良反应。新药是指未曾在中国境内上市销售的药品或已生产的药品改变剂型、改变给药途径、增加新的适应证或制成新的复方制剂,新药研发过程包括临床前研究和临床研究 2 个阶段。

(王巧云)

第二章 药物代谢动力学



目标要求

1. 掌握：药物代谢动力学、吸收、分布、代谢、排泄以及药物代谢动力学参数的概念；一级动力学、零级动力学的特点。
2. 熟悉：药物主动转运和被动转运的特点、血浆蛋白结合的临床意义。
3. 了解：表观分布容积、时效关系、时量关系的概念。

药物代谢动力学（pharmacokinetics）简称为药代动力学、药动学，是研究机体对药物的作用及作用规律的一门学科。机体对药物的作用是指药物的体内过程，包括吸收（absorption）、分布（distribution）、代谢（metabolism）和排泄（excretion）；机体对药物的作用规律是指体内药物随时间的变化规律，通常运用数学原理和方法阐述血浆药物浓度随时间的变化规律，表达药物在体内的动态规律。

第一节 药物分子的跨膜转运

一、药物通过细胞膜的方式

药物的体内过程如吸收、分布、代谢和排泄均需通过各种生物膜，这一过程称为药物的跨膜转运。药物在体内的跨膜转运方式主要有以下几种。

（一）被动转运（passive transport）

被动转运是指药物由高浓度一侧向低浓度一侧的扩散过程，为不耗能的顺浓度差转运，多数药物按此方式转运。膜两侧浓度差越大，药物转运的速度越快。水溶性药物通过细胞膜上的水性通道进行跨膜转运，这种方式称为滤过（filtration）；脂溶性药物则通过溶解于细胞膜的脂质层进出细胞，称为简单扩散（simple diffusion）。

（二）主动转运（active transport）

主动转运是指药物从浓度低的一侧向浓度高的一侧转运。主动转运的特点有：①需要载体，且载体对药物具有特异性和选择性；②消耗能量；③存在竞争性抑制现象；④具有饱和现象。如青霉素和丙磺舒均由肾小管同一载体转运排泄，两药同时应用时，因丙磺舒占据了大量载体而使青霉素的主动转运被竞争性抑制，使排泄减少，血药浓度维持时间延长，从而增强了青霉素的抗感染效果。

（三）其他转运方式

除上述转运方式外，体内的药物转运还可通过胞饮、胞吐等方式进行。

二、影响药物通透细胞膜的因素

(一) 药物的解离度和溶液的酸碱度

大多数药物为弱电解质，在体液中发生解离，以分子型（非解离型）和离子型（解离型）两种形式存在，二者处于平衡状态。分子型药物可以自由透过细胞膜，而离子型药物不能透过细胞膜，被限制在膜的一侧，这一现象称为离子障（ion trapping）。临床上有时可通过改变体液 PH 影响药物的跨膜转运，来降低药物的毒副反应。

(二) 药物浓度差及细胞膜通透性、面积和厚度

药物以简单扩散方式通过细胞膜时，除受药物的解离度和体液的 pH 影响外，药物分子跨膜转运的速度还符合 Fick 定律：

通透量（单位时间分子数）= $(C_1 - C_2) \times \text{面积} \times \text{通透系数} / \text{厚度}$

上式表明药物通过细胞膜的速率与膜两侧的药物浓度差（ $C_1 - C_2$ ）、膜面积、药物分子的通透系数（脂溶度）成正比，与膜的厚度成反比。膜面积大的器官，如肺、小肠，药物通过其细胞膜的速度远比膜表面积小的器官（如胃）快。

(三) 血流量

血流量的改变也可影响膜两侧药物浓度差，药物被血流带走的速度决定了膜一侧的药物浓度。当血流量丰富，血流速度快时，不含药物的血液能迅速取代含有较高药物浓度的血液，从而以维持很大的浓度差，使药物跨膜转运速率加快。

(四) 细胞膜转运蛋白的数量和功能

营养状况和蛋白质摄入影响细胞膜转运蛋白的数量，从而影响药物的跨膜转运。

第二节 药物的体内过程

药物由给药部位进入机体产生药效，然后再由机体排出，其间经历吸收、分布、代谢和排泄四个基本过程。了解药物的体内过程对于把握药物的体内动态变化规律有着重要的意义。

一、吸收

药物自用药部位进入血液循环的过程称为吸收 (absorption)。静脉内给药没有吸收过程，经血管外给药后如口服、舌下、直肠、吸入、肌内注射、皮下注射等均有药物的吸收过程。药物吸收的速度与药物作用快慢有关，吸收的量与药物作用的强度有关。影响药物吸收的因素主要有以下几方面。

(一) 药物的理化性质

分子量小、脂溶性高、极性低以及非解离型药物易被吸收，强酸、强碱和极性强的季铵盐，如骨骼肌松弛剂筒箭毒碱，均不易吸收。

(二) 药物的制剂

同一药物制成不同剂型，可影响吸收的速度和程度，溶液剂比固体制剂容易吸收，固体制剂的崩解、溶解速度是吸收的限速因素，油剂、混悬剂或植入片可在局部滞留，形成贮存库，吸收慢但作用持久。

（三）给药途径

不同给药途径影响药物的吸收速度和程度，吸收速度快慢的顺序为：吸入、肌内注射、舌下、直肠、皮下注射、口服、皮肤。吸收程度以吸入、肌内注射、舌下、直肠、皮下注射较完全，口服次之。多数药物均不易穿透完整的皮肤，少数脂溶性极高的药物及新型药物能经皮吸收。给药途径不同不仅影响药物吸收的速度和量，导致药物作用的快慢和强弱不同，甚至改变药物的作用性质，如硫酸镁口服产生导泻和利胆作用，注射给药产生中枢抑制、肌肉松弛和降压作用。不同给药途径有不同的吸收过程和特点。

静脉内给药时，药物可以完全被机体所利用。而口服药物经胃肠道吸收，先经门静脉进入肝脏，在进入体循环前被肠黏膜及肝脏酶代谢灭活或结合贮存，使进入体循环的药量明显减少，这种现象称首关消除 (first pass elimination) 或称首关效应 (first pass effect)。有明显首关消除的药物，口服给药时生物利用度低，必须加大用药剂量才能达到有效的治疗浓度，而代谢物增多又可产生毒性反应，因此应改变给药途径。采用舌下给药可在很大程度上避免首关消除，如硝酸甘油；直肠给药也可一定程度避免。

（四）机体状态

机体病理生理状态可影响药物的吸收，如年龄、性别、疾病等。口服给药受胃排空速度、胃内容物及胃肠蠕动快慢的影响。给药部位血流状态，如上臂三角肌比臀部肌肉血流丰富，注射药物吸收迅速而完全。处于休克、微循环障碍患者，肌内或皮下注射吸收缓慢而不完全，一旦纠正休克后全身血液循环改善，药物吸收明显增加，此时必须注意调整药物剂量，避免因血药浓度增高而引起毒性作用。

二、分布

分布 (distribution) 是指药物从血循环向各组织脏器、细胞间液和细胞内转运的过程。药物在体内的分布是不均匀的，随着药物的吸收和消除不断变化。药物的作用强度取决于药物分布到靶器官的浓度。药物在体内的分布受很多因素影响，包括药物的脂溶性、与血浆蛋白的结合率、毛细血管通透性、药物的理化性质和组织的 pH、器官组织的血流量、药物与组织的亲和力、药物转运载体的数量和功能状态、特殊组织的屏障作用等。

（一）药物与浆蛋白结合

药物进入血液循环后可不同程度地与血浆蛋白（主要是白蛋白，少量 β -球蛋白和酸性糖蛋白）结合，成为结合型药物。因而，药物在血循环中以结合型和游离型（活性型）两种形式存在。结合型药物的特点是：①暂时失去药理活性；②结合型药物分子量变大，不易透过毛细血管壁，影响到药物代谢和排泄；③药物与血浆蛋白的结合是可逆的，当游离型药物浓度下降时，结合型药物即可释放而转变成游离型药物，恢复其原有的药理活性；④药物与血浆蛋白结合具有饱和性，一旦达到饱和时，若继续增加用药剂量，可使血中游离型药物浓度明显增加，而引起药理效应增强甚至产生毒性作用；⑤药物与血浆蛋白结合的特异性低，蛋白结合率高的多种药物同时服用，药物间可发生竞争性置换 (competitive displacement) 现象，使其中某一药物游离型浓度增高，药物作用增强或产生毒性反应。如抗凝血药双香豆素口服，血浆蛋白结合率为 99%，若同时服用结合率为 98% 的保泰松，因竞争置换而使双香豆素结合率下降 1% 时，则游离型药物浓度在理论上将增加一倍，抗凝活性增强甚至引起出血。