



全国高等卫生职业教育创新型人才培养“十三五”规划教材

供医学美容技术专业使用



实用美容药物

张 何 高明春 姚苏宁◎主编



华中科技大学出版社

<http://www.hustp.com>



全国高等卫生职业教育创新型人才培养“十三五”规划教材
供医学美容技术专业使用

实用美容药物

主 编 张 何 高明春 姚苏宁

副主编 许代福 张戟风 戢丹菊

编 者 (以姓氏笔画为序)

牛 琳 郑州铁路职业技术学院

许代福 重庆三峡医药高等专科学校

张 何 辽宁医药职业学院

张培培 成都医学高等专科学校

张戟风 沧州医学高等专科学校

赵 超 沧州医学高等专科学校

姚苏宁 宁波卫生职业技术学院

高明春 白城医学高等专科学校

戢丹菊 鄂州职业大学



华中科技大学出版社

<http://www.hustp.com>

中国·武汉

内容简介

本书是全国高等卫生职业教育创新型人才培养“十三五”规划教材。

本书分为三篇共二十五章。基础篇主要介绍美容药物的基础知识,药物篇重点介绍在医学美容中广泛应用的护肤、养颜、抗衰老药物和损容性疾病的治疗药物,实验篇主要介绍美容药物实验须知、美容药物实验基本知识和美容药物实验。

本书主要供高职高专医学美容技术专业使用,也可作为从事医学美容的医师、护士,以及从事美容药物、护肤化妆品的研制、生产和销售工作者的参考书。

图书在版编目(CIP)数据

实用美容药物/张何,高明春,姚苏宁主编. —武汉:华中科技大学出版社,2016.8

全国高等卫生职业教育创新型人才培养“十三五”规划教材

ISBN 978-7-5680-2113-5

I. ①实… II. ①张… ②高… ③姚… III. ①美容-药理学-高等职业教育-教材 IV. ①R986

中国版本图书馆 CIP 数据核字(2016)第 186580 号

实用美容药物

张 何 高明春 姚苏宁 主编

Shiyoug Meirong Yaowu

策划编辑:居 颖

责任编辑:孙基寿

封面设计:原色设计

责任校对:张 琳

责任监印:朱 玢

出版发行:华中科技大学出版社(中国·武汉)

武昌喻家山 邮编:430074 电话:(027)81321913

录 排:华中科技大学惠友文印中心

印 刷:武汉市轩辕印务有限责任公司

开 本:787mm×1092mm 1/16

印 张:16.25

字 数:411千字

版 次:2016年8月第1版第1次印刷

定 价:46.00元



华中出版

本书若有印装质量问题,请向出版社营销中心调换

全国免费服务热线:400-6679-118 竭诚为您服务

版权所有 侵权必究

前言

QIANYAN

本书是全国高等卫生职业教育创新型人才培养“十三五”规划教材,主要供高职高专医学美容技术专业使用,也可作为从事医学美容的医师、护士,以及从事美容药物、护肤化妆品的研制、生产和销售工作者的参考书。

本书遵循“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)、“三特定”(特定的对象、特定的学制和特定的学时限制)的原则,以医学美容技术专业高职、高专教育为医学美容机构培养保健美容服务人员、医疗美容机构的医疗技术操作人员和医美咨询师的培养目标为依据,针对高职、高专学生的特点,充分体现高职、高专教育特色,在保持知识的系统性基础上,精心设计教材版面和编写内容,删繁就简,突出实用性、创新性。本书对教材内容的选择及排列进行了调整,力求符合教育教学规律和学生的认知规律,力求使教材成为教师好用、学生爱用、学了有用的好教材。本书重点介绍常用美容药物的作用、应用、不良反应以及制剂与用法。其特色在于每章设有学习目标和复习思考题,使学生能精准地学习、掌握每一章的教学内容。另外,将药理学的基本知识纳入教材中,以增加学生对药物的全面认识和理解。在教材中还增设了实验、实训内容,以提高学生对理论课教学的感性认识,加深和巩固对教学内容的理解和掌握,并以此培养学生的科学作风和实验技能。全书分三篇共二十五章。基础篇包括第一章至第六章,是美容药物的基础知识部分,重点介绍皮肤的组织结构和生理功能;美容药物经皮给药的特殊方法;外用美容药物的透皮吸收和透皮促进剂;美容药物的药理学知识和药剂学知识。药物篇包括第六章至第二十五章,重点介绍在医学美容中广泛应用的护肤、养颜、抗衰老药物和损容性疾病的治疗药物;增加了麻醉药、镇痛药、止血药与抗凝血药以及抗微生物药的内容。实验、实训篇包括美容药物实验须知、美容药物实验基本知识和美容药物实验。其中,第一章至第四章、第二十三章以及实验五由张何编写,并负责全书的统稿、第二次审改以及定稿的校对工作;第五章、第十四章、第二十二章以及实验八由许代福编写;第六章由张培培编写;第七章、第八章、第十七章以及实验三由高明春编写;第九章、第十二章、第二十四章以及实验六由张戟风编写;第十章和美容药物实验须知、美容药物实验基本知识以及实验一由赵超编写;第十一章、第十八章、第二十五章以及实验二由姚苏宁编写;第十三章、第十五章、第十六章以及实验七由戢丹菊编写;第十九章至第二十一章以及实验四由牛琳编写。

本书编写得到了所有参编单位的大力支持,本书参阅了许多相关书籍及文献,在此一并表示诚挚的感谢。

由于时间短、编者水平有限,疏漏及不足之处在所难免,敬请各位专家、同仁和学生予以指正。

张何

目录

MULU

基 础 篇

第一章 绪论	/ 3
第一节 美容药物概述	/ 3
第二节 美容药物发展简史	/ 4
第二章 美容药物的药理学知识	/ 6
第一节 药物效应动力学知识	/ 6
第二节 药物代谢动力学知识	/ 10
第三节 影响药物作用的因素	/ 15
第三章 皮肤及其附属器的组织结构和生理功能	/ 18
第一节 皮肤的组织结构	/ 18
第二节 皮肤及其附属器的生理功能	/ 22
第四章 外用美容药物的透皮吸收及其在皮肤中的代谢	/ 24
第一节 外用美容药物的透皮吸收	/ 24
第二节 影响外用美容药物透皮吸收的因素	/ 27
第三节 外用美容药物在皮肤的代谢	/ 34
第五章 美容药物经皮给药的方法	/ 37
第一节 直流电药物离子导入	/ 37
第二节 超声波药物导入	/ 39
第六章 美容药物的药剂学知识	/ 42
第一节 液体制剂	/ 42
第二节 软膏剂与面膜剂	/ 50
第三节 散剂	/ 56

药 物 篇

第七章 维生素	/ 63
第一节 脂溶性维生素	/ 63
第二节 水溶性维生素	/ 68
第三节 维生素之间的相互作用	/ 74
第八章 维 A 酸类	/ 78
第一节 概述	/ 78
第二节 常用维 A 酸类药物	/ 80



第九章 生物制剂	/ 88
第一节 细胞因子	/ 88
第二节 核酸类	/ 90
第三节 酶类及其他类	/ 90
第十章 α -羟酸类	/ 95
第一节 概述	/ 95
第二节 常用药物	/ 96
第十一章 抗过敏药与抗炎药	/ 98
第一节 抗过敏药	/ 98
第二节 抗炎药	/ 104
第十二章 防光剂	/ 108
第一节 日光的组成及生物学作用	/ 108
第二节 防光剂的作用及防晒效果评价	/ 108
第三节 常用的防光剂	/ 111
第十三章 皮肤增白药和着色药	/ 117
第一节 概述	/ 117
第二节 皮肤增白药	/ 118
第三节 皮肤着色药	/ 124
第十四章 延缓皮肤老化药	/ 129
第一节 皮肤老化的表现及机制	/ 129
第二节 美容嫩肤术用药	/ 129
第三节 促进表皮细胞生长药	/ 131
第四节 保湿剂	/ 133
第五节 改善微循环的药物	/ 137
第十五章 治疗痤疮的药物	/ 140
第一节 痤疮的发生机制及药物分类	/ 140
第二节 治疗药物	/ 141
第十六章 麻醉药	/ 146
第一节 局部麻醉药	/ 146
第二节 全身麻醉药	/ 147
第十七章 止血药与抗凝血药	/ 152
第一节 止血药	/ 153
第二节 抗凝血药	/ 154
第十八章 镇痛药	/ 159
第一节 阿片生物碱类镇痛药	/ 159
第二节 人工合成镇痛药	/ 160
第三节 其他类镇痛药	/ 161
第四节 阿片受体阻断药	/ 162
第十九章 消除瘢痕药	/ 164
第一节 瘢痕的形成机制与分类	/ 164

第二节 治疗药物	/ 165
第二十章 生发药和延缓白发形成药	/ 173
第一节 生发药	/ 173
第二节 延缓白发形成药	/ 178
第二十一章 脱毛药	/ 182
第二十二章 减肥药	/ 184
第一节 概述	/ 184
第二节 治疗药物	/ 185
第二十三章 止汗剂与祛臭剂	/ 192
第一节 止汗药	/ 192
第二节 抗菌药	/ 195
第三节 芳香剂	/ 196
第二十四章 医用美容生物材料	/ 199
第一节 概述	/ 199
第二节 医用美容高分子材料	/ 199
第三节 医用美容无机非金属材料	/ 201
第四节 医用美容金属材料	/ 203
第二十五章 抗微生物药	/ 204
第一节 抗微生物药概论	/ 204
第二节 抗生素	/ 206
第三节 人工合成抗菌药	/ 217
第四节 常用消毒防腐药	/ 221

实验、实训篇

美容药物实验须知	/ 233
第一部分 美容药物实验基本知识	/ 234
第二部分 美容药物实验	/ 241
实验一 普鲁卡因与丁卡因表面麻醉作用的比较	/ 241
实验二 药物的镇痛作用	/ 242
实验三 糖皮质激素的抗炎作用	/ 244
实验四 嫩肤水的制备	/ 245
实验五 保湿凝胶的制备	/ 246
实验六 维生素 E 乳的制备	/ 248
实验七 痱子粉的制备	/ 249
实验八 剥离型润肤面膜的制备	/ 250
主要参考文献	/ 252

基础篇



第一章 绪 论

学习目标

1. 掌握药物、化妆品、美容药物的概念以及三者间的不同。
2. 熟悉美容药物学的任务。
3. 了解美容药物学的发展史。

第一节 美容药物概述

一、美容药物的概念及其与化妆品、外用药品区别

药物(drug)是指能影响机体生理功能及(或)细胞代谢过程,用于预防、治疗、诊断疾病及计划生育的化学物质。研究药物与机体相互作用与作用规律的科学称为药理学(pharmacology)。美容药物(cosmeceutical)是指为达到美容目的或治疗某些损容性疾病而应用的药物。如皮肤增白药、防光药、减肥药、脱毛药等,主要用于渴望美、追求美的健康人和某些患有损容性疾病的患者。美容药物与化妆品是有区别的。化妆品(cosmetics)是指以涂擦、喷洒或其他类似方法施于人体表面任何部位(皮肤、毛发、指甲、口唇、口腔黏膜等)以达到清洁、消除不良气味、护肤、美容和修饰目的的产品,它不影响人体的结构和功能。而美容药物与一般的药物一样,要和机体发生相互作用,从而产生药剂学、药物代谢动力学、药物效应动力学和治疗学变化的四个过程。美容药物与外用药品也是有区别的,无论在应用的对象上,还是用药的目的上都有所不同,二者不能相提并论。美容药物主要用于健康者,外用药物的应用对象是患者。美容药物是以美容为目的,外用药物是以预防、治疗、诊断疾病为目的。另外,美容药物作用缓和,不允许有副作用存在,对其安全性的要求也比其他药物严格。

二、美容药物的研究对象和任务

随着经济的发展和人民生活水平的不断改善,人们对美的意识也在逐渐提高。现在人们对皮肤、毛发的日常护理和保养非常重视,越来越多的人通过使用各类化妆品或走进美容院、理发店进行美容美发。另外,在医院皮肤美容科,因患有痤疮、面部色素斑、脱发等影响个人形象的患者人数也在逐渐增多。美容药物的任务是:阐明美容药物的作用及作用机制,为临床合理应用美容药物提供科学的理论依据;正确指导临床应用美容药物,满足人们对美的追



求,避免由于不当使用美容药物引发皮肤美容损害,并防止医疗美容事故的发生;探索机体的生理功能、生化过程及疾病的病理过程,为美容药物的研究开发、美容药物制剂的研制提供实验资料。

第二节 美容药物发展简史

爱美是人类的天性,爱美之心人皆有之。中国是世界文明古国,有着传统的爱美习俗。早在古代,人们就有自觉的人体审美意识。最早的美容行为是洗脸,以后又流行面部敷粉,继之在春秋战国时期又出现了面脂、唇脂、发蜡等。我们的祖先不仅创造和积累了许多美容的方药和方法,并将这些经验记载于许多药物学著作中,为后人所用。

公元一世纪的《神农本草经》是我国最早的一部药物学著作,是药物和食膳美容的先驱之作。该书载药 365 种,涉及美容保健或美容治疗作用的药物 160 余种。其中有蜂子、白芷、白僵蚕等,如“蜂子,味甘平,久服令人光泽,好颜色”,白芷“长肌肤润泽,可作面脂”等,并明确提出了“面脂”这种独特的美容剂型,目前这些药物也作为常用的美容药物为后世所用。

在战国时期,人们开始有身佩或口含香花、香草的习惯,以使身体散发香气,改变人体不良气味。秦汉三国时期这种习惯更为普遍,汉朝妇女一般都佩戴装有香料的香囊,香料的使用作为上层统治者的专利香水在汉墓出土文物中得到了证实。对香料的普遍使用为今日香水的诞生和发展掀开了历史的第一页。战国时期的《山海经》记载药物 173 种,其中也有美容药物的记载,如“荀草,服之美人色”等。

两晋南北朝齐梁的著名医学及道教理论家陶弘景对《神农本草经》中的 365 种中药逐一整理,在此书基础上,又增加了 365 种中药,编著出《本草经集注》。对《神农本草经》中未提及药物的美容功效进行了补充,如增加了蛇床子“久服好颜色”、藁本“可作沐药面脂”的描述。

唐代医学家孙思邈的《备急千金要方》和《千金翼方》总收方 6000 多首,收有 130 首美容秘方,并为美容药物专辟了“面药”和“妇人面药”篇。另有供内服、外用的各类美容保健及治疗方药 200 余首。方剂制作精良,剂型多样,用法各异。

明代伟大的医药学家李时珍所著的《本草纲目》是一部举世闻名的药物学巨著。该书载药 1892 种,与美容有关的药物有数百种,分收在“诸风”、“眼目”、“面”、“鼻”、“唇”等篇中,可称中医药美容大全,为中药美容研究提供了非常宝贵的资料。

清朝的美容主要在宫廷中有较大发展,对美容方药的运用从内服到外用极为考究。乾隆年间皇帝非常讲究美容香体,并亲自过问美容之事。慈禧太后对美容更为重视,在遗留至今的清代宫廷医案中和《慈禧光绪医方选议》中可见长寿医方、长发香发方等。

目前,随着改革开放和人民生活水平的不断提高,随着与世界许多国家交流协作的增加、世界名牌化妆品的引进以及各大、中、小城市美容院和医疗美容机构的建立,人们对美的追求日益高涨,纷纷走进化妆品商场,购买化妆品;走进美容院以及整形美容机构,进行护肤、美容保健和整形,再现靓丽的外观,提升审美。在这样一种形势下,各大医药院校相继开设了医疗美容专业,以满足人们对美的需求和培养更多的美容方面专业人才。美容药物也作为一门美容专业学生必修课开设,美容药物学方面的著作以及医疗美容相关期刊也应运而生。

现代美容药物随着生命科学、药学、材料科学的发展得到了飞跃的发展, α -羟酸类、芦荟产品、中药提取物制成的化妆品、维 A 酸类、生物材料、胶原蛋白、玻尿酸以及微整技术等

肤美容和矫正人体缺陷上起到了重要的作用。相信随着科学技术的进步,医疗美容技术会得到进一步的提高和发展,美容药物也将为创造和美化人民生活做出更大的贡献。

小结

药物是指能影响机体生理功能及(或)细胞代谢过程,用于预防、治疗、诊断疾病及计划生育的化学物质。化妆品是指以涂擦、喷洒或其他类似方法施于人体表面任何部位,以达到清洁、消除不良气味、护肤、美容和修饰目的的产品,它不影响人体的结构和功能。美容药物是指为达到美容目的或治疗某些损容性疾病而应用的药物。美容药物通过与机体发生相互作用产生药剂学、药物代谢动力学、药物效应动力学和治疗学变化的四个过程。美容药物与外用药品无论在应用的对象上,还是用药的目的上都是有区别的。

美容药物的发展始于古代,我们的祖先不仅创造和积累了许多美容的方药和方法,并将这些经验记载于许多药物学著作中,一直流传至今,为后人所用。现代美容药物发展迅速,新产品不断涌现,在皮肤美容和矫正人体缺陷上起到了重要的作用。各个医药院校不仅开设了医疗美容专业,而且把美容药物作为医疗美容专业学生的一门必修课开设,美容药物相关的著作以及期刊也应运而生。相信美容药物在不久的将来将会为创造和美化人民生活做出更大的贡献。

复习思考题

1. 什么是美容药物? 什么是化妆品? 二者有何区别?
2. 美容药物的任务是什么?

(张 何)

第二章 美容药物的药理学知识

学习目标

1. 掌握本章所涉及的基本概念;掌握药物的基本作用、作用类型、不良反应种类及其特点;受体的性质,受体的激动药与阻断药;掌握药物的体内过程及其影响因素,常用药动学参数及其临床意义;并认识本章内容对美容药物临床应用的影响。
2. 正确认识药物作用的选择性及两重性,熟悉药物的量效关系、药时曲线,为药物篇的学习及合理用药奠定理论基础。
3. 了解药物作用的机制,药物的转运,影响药物作用的因素。

第一节 药物效应动力学知识

药物效应动力学(pharmacodynamics)简称药效学,是药理学研究对象之一,研究药物对机体的作用及其机制,即研究机体在药物作用下发生的生理、生化变化及其机制。药效学的研究可为指导临床合理用药以及新药的研究开发提供科学依据,同时也可以促进生命科学的发展。美容药物也如此,在美容药物问世前也需要进行美容相关作用的研究,以证实药物的作用和存在的不良反应,为美容药物的应用提供理论依据。

一、药物作用

药物作用(drug action)是指药物与机体组织细胞间的初始作用。药理效应(pharmacological effect)是由药物作用引起的机体组织器官原有功能的改变。二者存在因果关系,药物作用是因,药物效应是果。由于两者意思相近,故互相通用。

(一) 药物的基本作用

1. 兴奋作用 凡能使机体原有生理、生化功能增强的作用称为兴奋作用。如:维生素C的加强心肌收缩力、增加心输出量、升高血压作用;生发药促进毛发生长作用。

2. 抑制作用 凡能使机体原有生理、生化功能减弱的作用称为抑制作用。如:地西泮的镇静作用;曲马多的镇痛作用;止汗剂的抑制汗腺分泌作用。

(二) 药物作用的类型

1. 局部作用 药物在被吸收入血之前,在用药部位产生的作用。如:化妆品的皮肤护理

作用;碘酊的皮肤消毒作用; α -羟酸类的表皮剥脱作用;物理性防光剂的防晒作用。

2. 全身作用 也称吸收作用,是指药物从给药部位吸收入血后,经血液循环分布到机体各个组织器官而产生的作用。如:吲哚美辛的抗炎作用;曲马多的镇痛作用;头孢菌素类的抗菌作用。

二、药物作用的选择性和两重性

1. 药物作用的选择性 药物进入机体后,对某些组织、器官产生明显的作用,而对其他组织、器官作用很弱或几无作用。药物作用的选择性与药物本身的化学结构有关。它是相对的,而不是绝对的,它和药物的剂量有关。药物作用的选择性其意义在于:理论上可作为药物分类的基础;应用上作为临床选药的依据。选择性高的药物可以有针对性地治疗某种疾病或症状,且副作用较少。选择性低的药物治疗时针对性不强,且副作用较多,但作用范围较广。

2. 药物作用的两重性

1) 治疗作用 凡符合用药目的,有利于防病、治病的作用称为治疗作用。按治疗目的分为对因治疗(治本)和对症治疗(治标)。

2) 不良反应 凡是不符合用药目的并给患者带来痛苦和危害的反应统称为不良反应。多数不良反应是药物固有作用的延伸,一般是可以预知的,且停药后可以自行恢复。不良反应包括以下几种。

(1) 副反应 也称副作用,是药物在治疗剂量时出现的与治疗目的无关的作用。副反应具有以下特点:①副反应是药物固有的作用;②一般较轻微,可预知,且多数是可以恢复的机体功能性变化;③副作用和治疗作用可因用药目的不同而相互转化,当药物的某一作用被用作治疗作用时,其他作用则成为副作用。

(2) 毒性反应 药物在用药剂量过大、用药时间过久或机体对药物敏感性过高时产生的危害性反应。毒性反应可引起机体组织器官功能异常或出现器质性损害。毒性反应可以预知,一般比较严重,也是应该避免发生的不良反应。毒性反应可因药物剂量过大而立即发生,称为急性毒性,多损害循环、呼吸以及神经系统的功能。长期用药在体内蓄积后逐渐产生的毒性反应称为慢性毒性,常损害肝、肾、骨髓、内分泌系统等功能。

(3) 变态反应 也称过敏反应,是药物引起的异常免疫反应。致敏物质可以是药物本身、药物的代谢产物或药物制剂中的辅料或杂质。变态反应的特点:①常见于少数过敏体质的患者;②其发生与药物的药理作用和剂量无关,但反应的程度与剂量有关;③反应性质因人而异不尽相同,不易预知,一旦对某种药物过敏则是终生的;④结构相似的药物可有交叉过敏反应。常见表现:发热、皮疹、血管神经性水肿、哮喘、血清病样反应,最严重的过敏反应就是过敏性休克。如青霉素,头孢菌素类都有发生过敏性休克的可能,使用前需做过敏试验,阳性者当禁用有过敏反应的药物。过敏反应在皮肤护理中也经常会遇到,表现为:皮肤发红、干燥、脱水、脱皮、发痒等。尤其是皮肤性质属敏感肌肤的人,这样的人在初次使用新的化妆品或是更换化妆品时,要做皮肤刺激性试验,无反应才可以使用。但也存在假阴性反应,用几天后才出现过敏,一旦过敏当立即停止使用,不能用手抓挠,应采取冷敷、服用抗过敏药等措施。

(4) 停药反应 患者长期应用某种药物,突然停药后原有疾病出现加剧的现象,又称反跳反应。如长期服用 β -受体阻断药的高血压患者,突然停药,血压会出现急剧升高;肥胖症患者停用减肥药后会出现体重反弹。

(5) 后遗效应 停药后血药浓度已降至阈浓度以下时仍残存的药理效应称为后遗效应。



此种效应可能非常短暂,也可能比较持久。如失眠者服用巴比妥镇静催眠药次日晨有乏力、困倦的现象;长期应用糖皮质激素类药物,停药后出现持续时间长且难以恢复的肾上腺皮质功能低下。

(6) 继发反应 继药物治疗作用后所产生的不良后果称为继发反应,或称为治疗矛盾。如长期应用广谱抗生素引起的二重感染。

(7) 特异质反应 某些药物可以使少数患者出现特异性的不良反应,反应性质可能与常人不同。目前认为特异质反应多半发生在有遗传性生化缺陷的患者。

(8) 三致反应 致畸、致癌、致突变作用称为三致反应,是药物损伤细胞遗传物质所致的特殊毒性反应。药物损伤 DNA、干扰 DNA 复制引起的基因变异或染色体畸变称为致突变;基因突变发生在胚胎生长细胞可致畸;药物造成 DNA 或染色体损伤,使抑癌基因失活,原癌基因激活,导致正常细胞向癌细胞转变称为致癌。

三、药物的量效关系

1. 剂量 用药的分量。

(1) 最小有效量(阈剂量) 产生疗效所需的最小剂量。

(2) 治疗量(常用量) 比阈剂量大,比极量小的剂量。

(3) 极量 能引起最大效应而又不发生中毒反应的剂量(即安全用药的极限)。

(4) 最小中毒量 超过极量而引起毒性反应的最小剂量。

(5) 半数致死量(LD_{50}) 能使一组实验动物半数死亡的剂量。半数致死量是反映药物急性毒性大小的重要参数。

(6) 半数有效量(ED_{50}) 能产生 50% 最大效应(量反应)或 50% 阳性反应(质反应)的剂量。半数有效量是反映药物治疗效应的重要参数。

2. 量效关系 在一定的剂量范围内,药物的效应随药物剂量的增减而增强或减弱,这种关系称为药物的剂量与效应关系,即量效关系。

(1) 量反应 药理效应强弱可用数或量的分级表示,如血压的升降、平滑肌的舒缩等。

(2) 效价强度 药物达到一定药理效应所需的剂量,反映药物与受体的亲和力的大小,常用于作用性质相同药物之间等效剂量的比较。达到同等药理效应所需剂量越小表明效价强度越大;反之,则效价强度越小。常用产生 50% 最大效应时的剂量来表示即半数有效量(ED_{50})。

(3) 效能 药物产生最大药理效应的能力,反映药物内在活性的大小。

(4) 质反应 药理效应可用全或无,阳性或阴性表示,如生存与死亡、抽搐与不抽搐等。

四、药物的安全性评价

1. 治疗指数 半数致死量和半数有效量的比值(LD_{50}/ED_{50})。比值越大相对安全性越大。反之,则越小。

2. 药物安全范围 药物的最小有效量与最小中毒量之间的距离,其值越大越安全。

五、药物作用机制

1. 作用于受体 这是大多数药物的作用机制,如治疗痤疮药螺内酯通过与胞浆内雄激素受体结合,阻断雄激素作用,减少皮脂腺腺体分泌来治疗寻常痤疮。

2. 影响酶的活性 生发药非那甾胺通过抑制 5- α 还原酶活性,阻止睾酮转变成二氢睾酮,从而促进毛发生长。

3. 影响细胞膜离子通道 如局麻药通过阻滞钠通道,抑制钠离子内流,影响神经膜去极化,阻止神经冲动的产生和传导产生麻醉作用。

4. 干扰核酸代谢 如磺胺类、喹诺酮类抗菌药就是通过抑制二氢叶酸合成酶、DNA 回旋酶影响核酸合成产生抗菌作用。

5. 补充体内物质 如维生素类药物可以补充机体因维生素缺乏所致各种疾病。

6. 改变细胞周围环境的理化性质 如 pH 值、渗透压等。

7. 影响生理活性物质及其转运体 如减肥药影响神经递质去甲肾上腺素(NA)、5-羟色胺(5-HT)的再摄取及体内多肽激素瘦素水平。

8. 影响机体免疫功能 如免疫抑制剂环孢素 A 用于器官移植抗排斥反应。

9. 非特异性作用 略。

六、药物与受体

(一) 受体的概念

受体是存在于细胞膜、细胞质或细胞核内,能识别、结合特异生物活性分子,并能传递信息和引起效应的大分子蛋白质。配体是能与受体发生特异性结合的物质。配体包括内源性配体和外源性配体:内源性配体如神经递质、激素、自身活性物质等,外源性配体即药物。

(二) 受体的特征

1. 特异性 一种受体只能与其相应的配体结合产生特定的生物效应。

2. 饱和性 受体的数目是有限的,能与之结合的配体也是有限的。

3. 可逆性 配体可以与受体通过化学键结合形成配体-受体复合物,也可以从复合物上解离下来。能与同一受体结合的两种配体之间存在竞争置换现象。

4. 高灵敏性 受体只需与极低浓度的配体结合就可以产生明显的药理效应。

5. 多样性 同一受体可广泛分布于不同的细胞产生不同的效应。受体多样性是受体亚型分类的依据。

6. 高亲和性 受体与其结构相似的配体具有高度的亲和力。

(三) 受体的类型

1. 配体门控离子通道受体 这类受体组成细胞膜上的离子通道,控制离子通道的开放,调控细胞膜内外离子的流动。如 γ -氨基丁酸受体、N 胆碱受体、甘氨酸受体等。

2. G-蛋白偶联受体 一类由 GTP 结合调节蛋白(G 蛋白)组成的受体超家族,可将配体带来的信号转导给效应器产生生物效应。如 M 胆碱受体、肾上腺素受体、多巴胺受体、5-羟色胺受体等。

3. 酪氨酸激酶受体 这是一类具有酪氨酸激酶活性的受体,能催化各种底物蛋白磷酸化,激活细胞内蛋白激酶,产生细胞生长、分化等效应。如胰岛素受体、表皮生长因子受体等。

4. 细胞内受体 此类受体大多存在于细胞质,内有配体识别区域和 DNA 结合区域,能调节细胞核内信号转导和基因转录过程。如甾体激素受体、甲状腺激素受体、维生素 D 和维生素 A 受体。



(四) 药物与受体的相互作用

药物与受体结合并产生效应必须具备以下两个条件:一是亲和力,即药物与受体结合的能力。二是效应力,即药物与受体结合后产生效应的能力,也称内在活性。

根据受体与药物的亲和力和药物本身的内在活性的大小,可将药物分为激动药与拮抗药。

1. 激动药 药物与受体有较强的亲和力和较强的内在活性,与受体结合后能激动受体产生效应。

(1) 完全激动药 具有较强的亲和力和内在活性。

(2) 部分激动药 与受体有较强的亲和力和较弱的内在活性。本身单独应用时,可产生弱的激动效应,作为激动药使用。如与激动药合用,可拮抗激动药的部分效应起拮抗药作用。因此,部分激动药具有激动药和拮抗药两重特性。

2. 拮抗药 与受体有较强的亲和力,而本身无内在活性,但因占据受体拮抗激动药的效应。根据与受体结合是否具有可逆性,分为如下两种。

(1) 竞争性拮抗药 能与激动药可逆性地竞争同一受体,拮抗激动药的作用。有竞争性拮抗药存在时,量效反应曲线平行右移,斜率和高度不变。

(2) 非竞争性拮抗药 与激动药不可逆地竞争与受体结合,虽然不是与激动药争夺相同受体,但它与受体结合后,改变了效应器的反应性,因此不仅使激动药量效反应曲线右移,而且能抑制最大效应,斜率降低,高度压低。

(五) 受体调节

受体数目、亲和力和效应力受生理、病理或药物因素的影响而发生变化称为受体调节。受体调节是维持机体内环境稳定的主要因素。受体调节包括如下两点。

1. 受体增敏 长期应用受体阻断药使受体数目增多,亲和力、效应力增强,受体对激动药的敏感性和反应性增强的现象。受体增敏是某些药物停药反跳的原因。

2. 受体脱敏 长期使用激动药使受体数目减少,亲和力、效应力降低,受体对激动药的敏感性和反应性下降的现象。受体脱敏是产生耐受性的原因之一。

(六) 第二信使

受体在识别相应配体并与之结合后需要细胞内第二信使将获得信息增强、分化、整合并传递给效应机制才能发挥其特定的生理功能或药理效应。这种将细胞外信息传递到细胞内的过程称为信号转导。现已确定的第二信使包括:环磷腺苷(cAMP);环磷鸟苷(cGMP);磷酸肌醇(IP₃);甘油二酯(DG);钙离子。

第二节 药物代谢动力学知识

药物代谢动力学简称药动学(pharmacokinetics),是研究机体对药物的处置过程及其规律,即研究药物在体内的动态变化规律的学科。研究内容包括:①药物的体内过程,包括吸收、分布、代谢和排泄;②药物在体内随时间变化的速率过程。化妆品涂擦在皮肤上和美容药物的使用都存在药动学过程。