

药理学

(军医专业教材)

(上册)

中国人民解放军第二军医大学编

一九八六年元月

目 录

第一篇 药理学总论

| | | |
|-------------------|-------|----|
| 绪言 | (谭建权) | 1 |
| 第一章 药物的来源和制剂 | (谭建权) | 4 |
| 第一节 药物的来源 | | 4 |
| 第二节 植物药的有效成分 | | 4 |
| 第三节 药物的制剂 | | 5 |
| 第四节 药典 | | 7 |
| 第二章 药效动力学 | (谭建权) | 9 |
| 第一节 药物的作用 | | 9 |
| 第二节 药物作用的原理 | | 14 |
| 第三节 药物的化学结构与药效的关系 | | 18 |
| 第四节 药物的剂量与药效的关系 | | 20 |
| 第三章 药代动力学 | (谭建权) | 27 |
| 第一节 药物的跨膜转运 | | 27 |
| 第二节 药物的体内过程 | | 33 |
| 第三节 血浆药物浓度的动态变化 | | 44 |
| 第四章 影响药物作用的因素 | (谭建权) | 56 |
| 第一节 机体方面的因素 | | 56 |
| 第二节 药物方面的因素 | | 60 |
| 第三节 环境和时间因素 | | 63 |
| 第四节 遗传因素的影响 | | 64 |
| 第五章 处方学 | (谭建权) | 66 |
| 第一节 处方的规则 | | 66 |
| 第二节 处方示例 | | 67 |

第二篇 作用于传出神经末梢区域的药物

| | | |
|-------------------|-------|----|
| 概论 | (谭世杰) | 71 |
| 第六章 拟胆碱药 | (谭世杰) | 82 |
| 第一节 作用于M受体与N受体的药物 | | 83 |
| 乙酰胆碱 | | |
| 第二节 作用于M受体的药物 | | 84 |
| 毛果芸香碱、乌拉胆碱 | | |
| 氧化震颤素 | | |
| 第三节 抗胆碱酯酶药 | | 85 |

毒扁豆碱、新斯的明、吡啶斯的明、加兰他敏

| | |
|--|-----|
| 第七章 抗胆碱药 (谭世杰) | 89 |
| 第一节 M-胆碱受体阻断药 | 89 |
| 阿托品、东莨菪碱、山莨菪碱 | |
| 第二节 N-胆碱受体阻断药 | 93 |
| 右旋筒箭毒碱、肌安松、潘寇罗宁、琥珀酰胆碱 | |
| 第八章 有机磷酸酯类中毒与解救 (谭世杰) | 98 |
| 一、有机磷酸酯的分类..... | 98 |
| 二、有机磷酸酯中毒的原理..... | 100 |
| 三、有机磷酸酯中毒的症状..... | 100 |
| 四、有机磷酸酯中毒的治疗..... | 100 |
| (一)阿托品或东莨菪碱..... | 100 |
| (二)胆碱酯酶复活剂..... | 100 |
| 解磷定、氯磷定、双复磷 | |
| (三)安定..... | 102 |
| 第九章 拟肾上腺素药与抗肾上腺素药 (谭世杰) | 104 |
| 第一节 拟肾上腺素药..... | 108 |
| 肾上腺素、麻黄碱、去甲肾上腺素、甲氧胺、新福林、阿拉明、 恢压敏、异丙肾上腺素、多巴酚丁胺、多巴胺 | |
| 第二节 抗肾上腺素药..... | 116 |
| 一、 α 型抗肾上腺素药(α 受体阻断药)..... | 117 |
| 妥拉苏林、酚妥拉明、酚苄明、海得琴 | |
| 二、 β 型抗肾上腺素药(β 受体阻断药)..... | 118 |

第三篇 作用于中枢神经系统的药物

| | |
|--|-----|
| 概论 (曹龙光) | 125 |
| 第十章 镇静催眠药 (曹龙光) | 125 |
| 第一节 巴比妥类..... | 126 |
| 第二节 抗焦虑药..... | 132 |
| 利眠宁、安定、舒宁、硝基安定、氯硝安定、眠尔通、羟咪 | |
| 第三节 其它镇静催眠药..... | 136 |
| 水合氯醛、副醛、导眠能、安眠酮、溴化物 | |
| 第十一章 抗癫痫药 (曹龙光) | 140 |
| 苯妥英钠、苯巴比妥、扑痫酮、乙琥胺、安定、硝基安定、氯硝安定、 卡巴咪唑、丙戊酸钠、抗痫灵 | |
| 癫痫治疗的一般原则和药物选择..... | 146 |
| 第十二章 治疗震颤麻痹的药物 (顾科民) | 149 |
| 盐酸苯海索、左旋多巴、金刚烷胺、溴麦角隐亭 | |

| | |
|---|-----|
| 第十三章 治疗精神失常的药物 (顾科民) | 153 |
| 第一节 抗精神病药 | 153 |
| 一、吩噻嗪类..... | 154 |
| 氯丙嗪、奋乃静、氟奋乃静、三氟拉嗪、甲硫哒嗪 | |
| 二、硫杂蒯类..... | 162 |
| 泰尔登 | |
| 三、丁酰苯类..... | 163 |
| 氟哌啶醇、哌啶 | |
| 四、其它..... | 163 |
| 五氟利多、氯氮平、舒必利 | |
| 第二节 治疗情感障碍病的药物 | 164 |
| 一、抗躁狂药..... | 165 |
| 碳酸锂 | |
| 二、抗抑郁药..... | 166 |
| 丙咪嗪、阿密替林、多虑平、苯乙肼、异菟胍、米塞林 | |
| 第十四章 镇痛药 (顾科民) | 171 |
| 概论 | 171 |
| 第一节 阿片碱类 | 174 |
| 吗啡、可待因、阿片制剂 | |
| 〔附〕 吗啡拮抗剂(纳络酮、纳屈酮、烯丙吗啡) | |
| 第二节 人工合成品 | 181 |
| 哌替啶、阿那度、美散痛、芬太尼、镇痛新 | |
| 第三节 延胡索、延胡索乙素与颅痛定 | 185 |
| 第十五章 解热镇痛消炎药 (顾科民) | 188 |
| 第一节 作用原理与应用原则 | 188 |
| 第二节 常用药物 | 191 |
| 阿司匹林、水杨酸钠、扑热息痛、非那西丁、氨基比林、安乃近、安替比林、保泰松、羟基保泰松 | |
| 第三节 新型消炎镇痛药 | 197 |
| 氯灭酸、消炎痛、布洛芬、萘普生 | |
| 第四节 解热镇痛药的复方制剂 | 199 |
| 第十六章 麻醉药 (顾科民) | 202 |
| 第一部分 全身麻醉药 | 202 |
| 第一节 吸入麻醉药 | 203 |
| 一、概述..... | 203 |
| 二、常用的吸入麻醉药..... | 208 |
| 乙醚、氟烷、氧化亚氮、甲氧氟烷、安氟醚、三氟乙烯、氯乙烷 | |
| 第二节 静脉麻醉药 | 213 |
| 硫喷妥钠、氯胺酮、 γ -羟丁酸钠、普尔安 | |

| | | |
|-------------|---------------------------------|-----------|
| 第三节 | 中药麻醉 | 216 |
| 第四节 | 全身麻醉综合用药 | 218 |
| 第二部分 | 局部麻醉药 | 220 |
| 第一节 | 概述 | 221 |
| 第二节 | 常用局麻药 | 225 |
| | 普鲁卡因、利多卡因、丁卡因、布比卡因 | |
| | 其它局麻药 | |
| 第十七章 | 中枢兴奋药 | (顾科民) 229 |
| 第一节 | 基本概念 | 229 |
| 第二节 | 常用的中枢兴奋药 | 230 |
| | 咖啡因、尼可刹米、杜沙普拉姆、洛贝林、回苏灵、戊四氮、美解眠、 | |
| | 哌醋甲酯 | |

第四篇 影响内脏器官功能的药物

| | | |
|-------------|---|-----------|
| 第十八章 | 祛痰药、镇咳药、平喘药 | (郑可耀) 235 |
| 第一节 | 祛痰药 | 235 |
| | 氯化铵、桔梗和远志、N-乙酰半胱氨酸、溴苄环己铵、鲜淡竹沥、满山红、小叶枇杷 | |
| 第二节 | 镇咳药 | 238 |
| | 可待因、咳必清、半夏、贝母、矮茶素、复方甘草合剂 | |
| 第三节 | 平喘药 | 240 |
| | 肾上腺素、麻黄碱、异丙肾上腺素、羟甲叔丁肾上腺素、间羟叔丁肾上腺素、喘速宁、氨茶碱、喘定、异丙阿托品、二丙酸氯地米松、色甘酸钠、酮替芬 | |
| 第十九章 | 作用于消化系统的药物 | (谭建权) 250 |
| 第一节 | 助消化药 | 250 |
| | 稀盐酸、胃蛋白酶、胰酶、酵母、乳酶生、康胃素、山楂、鸡内金 | |
| 第二节 | 治疗消化性溃疡的药物 | 252 |
| 一、 | 抗酸药类 | 252 |
| | 碳酸氢钠、氧化镁、碳酸钙、三硅酸镁、氢氧化铝、硫糖铝 | |
| | 抗酸药合并应用的意义及注意事项 | 254 |
| 二、 | 组胺H ₂ 受体阻断药 | 255 |
| | 甲氧咪胺、雷尼替丁 | |
| 三、 | 解痉药 | 257 |
| 四、 | 其它 | 257 |
| | 丙谷胺、生胃酮、胃粘膜素 | |
| 第三节 | 泻药 | 258 |
| | 硫酸镁、硫酸钠、大黄、番泻叶、酚酞、蓖麻油、液状石蜡、甘油、开塞露 | |
| | 泻药的选择应用和应用注意事项 | 261 |

| | | |
|--------------|---|-----------|
| 第四节 | 止泻药 | 262 |
| | 阿片制剂、盐酸苯乙哌啶、盐酸洛哌胺、鞣酸蛋白、次碳酸铋、药用炭(活性炭)、矽炭银 | |
| 第五节 | 止吐药 | 264 |
| | 灭吐灵、止呕灵、吐来抗 | |
| 第六节 | 治疗肝脏疾病的辅助用药 | 266 |
| 一、 | 改善肝脏组织代谢的药物 | 266 |
| | 葡萄糖、维生素类(维丙肝等)、肝泰乐、肝宁、肌苷、水飞蓟素、阿卡明、细胞色素C、注射用能量合剂、辅酶A、三磷酸腺苷、胰岛素 | |
| 二、 | 抗脂肪肝药物 | 269 |
| | 胆碱、蛋氨酸、肝乐、肌醇 | |
| 三、 | 防治肝昏迷的药物 | 271 |
| | (一)减少肠内氨吸收的药物 | 271 |
| | (二)降低血氨的药物 | 272 |
| | (三)纠正肝昏迷时脑功能障碍的药物 | 273 |
| 第七节 | 利胆药 | 276 |
| | 胆酸钠、去氢胆酸、鹅去氧胆酸、利胆醇、利胆酚 | |
| 第二十章 | 利尿药和脱水药 | (朱铨英) 280 |
| 第一节 | 利尿药 | 280 |
| 一、 | 泌尿的生理与药物产生利尿作用的主要方式 | 280 |
| 二、 | 常用利尿药 | 284 |
| | 双氢氯噻嗪、环戊氯噻嗪、氯噻酮、速尿与利尿酸、丁苯氧酸、汞撒利、安体舒通、氯苯噻啶、氯氯吡脒、乙酰唑胺、利尿的中草药 | |
| 第二节 | 脱水药 | 294 |
| | 甘露醇、山梨醇、尿素、高渗葡萄糖 | |
| 第三节 | 利尿药的选择应用 | 295 |
| 第二十一章 | 抗高血压药 | (朱铨英) 299 |
| 第一节 | 交感神经系统抑制药 | 301 |
| 一、 | 外周交感神经末梢抑制药 | 301 |
| | 利血平、胍乙啶 | |
| 二、 | 改变中枢交感神经系统活性的药物 | 305 |
| | 可乐宁、 α -甲基多巴、氯苯乙胍、氯苄氨胍 | |
| 三、 | 肾上腺素受体阻断药 | 307 |
| | 心得安、哌唑嗪、柳胺苄心定 | |
| 四、 | 神经节阻断药 | 310 |
| | 美加明、三甲硫吩 | |
| 第二节 | 血管扩张药 | 310 |
| | 肼苯哒嗪、长压定、二氮嗪、硝普钠、硫酸镁、地巴唑、硝苯吡啶、粉防己碱 | |

| | | |
|--------------|--|-----------|
| 第三节 | 利尿降压药 | 314 |
| 第四节 | 血管紧张素转换酶抑制剂及肌丙素 | 315 |
| 第五节 | 降压中草药 | 317 |
| | 汉防己甲素、钩藤总碱及钩藤碱、罗布麻 | |
| 第六节 | 抗高血压药的应用原则 | 318 |
| 第二十二章 | 强心甙 | (郑可耀) 323 |
| | 洋地黄、洋地黄毒甙、狄戈辛、黄夹甙、西地兰、毒毛旋花子甙K、 羊角拗甙、铃兰毒甙、福寿草总甙 | |
| 第二十三章 | 抗心律失常药 | (郑可耀) 338 |
| 第一节 | 心律失常的电生理基础与抗心律失常药的作用机制及其分类 | 339 |
| 第二节 | 常用的抗心律失常药 | 344 |
| | 奎尼丁、普鲁卡因胺、双异丙吡胺、利多卡因、慢心律、室安卡因、 安室律定、苯妥英钠、心得安、溴苄胺、乙胺碘呋酮、异搏停 | |
| 第三节 | 抗心律失常药的选择应用 | 354 |
| 第二十四章 | 抗心绞痛药与降血脂药 | (姜渭) 358 |
| 第一节 | 抗心绞痛药 | 358 |
| 一、 | 硝酸酯与亚硝酸酯类 | 359 |
| 二、 | β 受体阻断剂 | 362 |
| | 心得安、心得平、心得静、氨酰心安、甲氧乙心安 | |
| 三、 | 钙拮抗剂 | 365 |
| | 硝苯吡啶、硫氮革酮、异搏定、心可定 | |
| 四、 | 其它 | 367 |
| | 潘生丁、延通心、脉心导敏、丹参、毛冬青、苏合香丸 | |
| 第二节 | 降血脂药 | 370 |
| | 消胆胺、降胆宁、降胆葡胺、谷固醇、氯苯丁酯、安妥明铝盐、安妥明丙 二醇酯、菸酸、菸酸肌醇酯、右旋甲状腺素钠、亚油酸、硫酸软骨素A、 降血脂中草药 | |
| 第二十五章 | 子宫收缩药 | (姜渭) 378 |
| | 垂体后叶制剂、麦角生物碱、前列腺素类、雷佛奴尔、益母草、当归 | |

第一篇 药理学总论

绪 言

目的要求

1. 了解药理学的任务，明确军医学习药理学的目的。
2. 了解药理学的发展与药理学研究方法。

药理学 Pharmacology 是研究药物防治疾病的一门科学^{[1][5]}。主要研究药物与机体相互作用的基本规律，具体内容包括：1. 研究药物对机体的影响，即药物效应动力学（简称药效学 Pharmacodynamics）。2. 研究机体对药物的影响，即药物代谢动力学（简称药代学 Pharmacokinetics）。3. 研究影响药物与机体相互作用的因素，以及研究药物作用的原理等。

药理学为临床合理用药提供基本理论。军医学习药理学的目的是掌握药物作用的基本规律，为学习临床医学和军事医学打下必要的理论基础，为平、战时保障广大工农兵健康、防治疾病和救护伤员中，能正确、有效、安全而节约地选用药物。

药物是防治疾病的物质，是几千年来广大劳动人民在与疾病作斗争的实践中，不断总结经验发展起来的。古代劳动人民在寻找食物时，发现食用某些植物后可出现一些特殊的反应，例如大黄致泻、麻黄平喘、苦楝驱虫等，以后经过长期反复实践，认识到利用这些植物治疗某些疾病获得效果，才逐步把它们列为泻下药、平喘药和驱虫药等。这就是药物的起源。

中国医药学是一个伟大的宝库，应当努力发掘，加以提高。祖国医药学已有数千年的光辉历史，其成就举世无与伦比^[2]。《黄帝内经》一书，乃是我国古代医药学家医疗实践经验的总结，其中包括了药物防治疾病的经验。历代非常有价值的药物学（古代称“本草”）名著有好多部，例如，早在公元一世纪，我国最早的一部药学专著《神农本草经》，系统地总结了我国古代劳动人民所积累的药物知识，共记载动、植、矿药物365种，叙述了许多药效知识，其中大部分仍为目前常用的中药。这部最早的药学著作，具有一定的科学价值。历代本草中较重要的有《本草经集注》（公元六世纪、梁），《新修本草》（公元七世纪、唐），《经史证类备急本草》（公元十二世纪、宋），《本草纲目》（公元十六世纪、明），《本草纲目拾遗》（公元十八世纪、清）等。其中唐代《新修本草》是世界上第一部由政府颁布的药物法典，它比西方国家最早的一部药典《纽伦堡药典》要早八百八十三年。明代的《本草纲

目》，著者李时珍在长期医药实践中，亲自上山采药，开辟药圃，栽培植物药，亲自考查许多药用植物的生态，解剖一些药用动物，采掘和炼制多种药用矿物，走遍了我国南北数省，跋山涉水，向农民、鱼民、樵夫、药农、铃医请教，积累了丰富的用药经验，参考医药专书800余种，以毕生的精力写成此书。全书52卷，约190万字，共载药物1892种，药方11,000余个，并提出了科学的药物分类法，内容丰富，曾被译为德、英、日、法、俄等文字。它不仅促进了祖国医药的发展，而且对世界药学的发展也作出了杰出的贡献。但是，历代反动统治者为了维护封建地主阶级的统治，竟把亿万群众与疾病作斗争的成果窃为己有，在一些重要的本草著作上冠以统治者的名字或年号，并有“药有君臣佐使”的说法；再如《神农本草经》据史学家考证，是公元前一世纪汉代学者对祖国上古时期劳动人民积累的药物、药理知识所作的总结。由于认识上的局限性，古代著作中也难免掺有封建迷信之类的东西。所以我们对祖国医药学遗产，在努力发掘，加以提高的同时，还必须去粗取精、去伪存真，而不能无批判地兼收并蓄。

药理学的建立和发展，与现代科学技术的发展紧密相关。十九世纪初，有机化学、生物学以及实验生理学的兴起，为建立现代药理学奠定了科学基础。本世纪廿年代，我国开始建立医学院校，开设实验药理学课程^[3]。但由于旧中国统治阶级不重视医药卫生保健事业，因此药理学进展缓慢。在解放前，药理学研究的主要对象是本草中所记载的中药，如麻黄、防己、贝母、常山等。新中国成立后，药理学的教学和科研工作者的队伍迅速壮大，药理学的科研工作也有很大发展，特别是中草药的研究取得了重要成就。例如从本草学中发掘了青蒿，并提出了抗疟有效成分青蒿素。在吗啡镇痛作用原理研究方面，我国药理学工作者于六十年代初期首先提出吗啡作用部位在第三脑室和导水管周围灰质的论据。此外，在化学治疗药、神经系统药、心血管系统药、防治老慢支和计划生育等方面做了大量工作取得很大成绩。今后，在实现四个现代化的进程中，随着国民经济的发展和科学技术的进步，我国药理学的发展必将会有新的成就出现，尤其在中西医结合的道路上取得更大的丰硕成果。

现代药理学已成为与生物化学、生物物理学、分子生物学以及应用数学等有关学科更加密切相联系的一门学科^[4]。因此，药理学的研究已从宏观进入微观，即从原来就整体观察药物的效应，逐步深入到亚细胞、分子水平以理解药物作用的原理，从而出现了药理学与其它一系列学科密切相联系的各分科。如分子药理学、生化药理学、神经药理学、精神药理学、免疫药理学、遗传药理学、时辰药理学、数学药理学、临床药理学等等。

现代药理学研究主要是依靠实验性探索来实现的。现代药理学的发展和理论体系的建立是和新思路的开拓，新技术的运用和新方法的创立是完全分不开的。

现代药理学实验方法，主要还是生理学和生物化学基本方法的利用和发展。根据实验对象的不同大体上可分为三大类^[1]。

一、实验药理学方法：（一）对健康动物进行药效学和药代动力学的观察。（二）在麻醉动物研究药物对器官或系统的影响。（三）采用动物离体器官、组织、细胞或细胞器等进行“离体试验”或“玻管试验”（In vitro test）。前两项都是在活体上观察，故称为“在

体实验”或“活体试验”(In vivo test)。

二、实验治疗学方法：根据实验目的预先在动物身上复制病理模型，然后应用药物治疗，观察药物的疗效与毒性作用。例如大部分化疗药物、抗癌药物和抗高血压药物等的研究都是利用实验治疗学的方法。

三、临床药理学方法：药物除在动物身上进行系统实验取得充分资料外，还必须在不损伤人体健康的条件下在人体上进行实验观察，才能对药物作出正确的评价。除了进行整体研究外，也可利用活组织检查的标本或外科手术切除的器官组织进行体外实验。临床药理学是当前世界上发展较快的一门学科，特别是无损性先进仪器设备的运用，药物微量测定方法的建立，以及应用数学在药理学中的应用，给临床药理学研究创造了有利的条件，它的研究成果，大大地提高了药物在临床应用的有效性和安全性，有力地指导创制新药的设计、给药方法的选择和药物剂型的改进。

参 考 文 献

1. 张昌绍：药理学研究对象、任务和研究方法，《药理学》，第三版，p.2~3，人民卫生出版社，北京，1965
2. 张毅：药理学发展简史，《药理学》，第一版，p.3~8，人民卫生出版社，北京，1959
3. 张毅：我国药理学的回顾与展望，《药理学进展》，p.1~15，人民卫生出版社，北京，1979
4. 谭世杰、廖锡麟：国外药理学近年进展情况概要，《国内外医学科学发展概况》，p.38~45，第二军医大学，1977
5. Fingl, E and Woodburg, DM: General principles, In the Pharmacological Basis of Therapeutic, 4th ed. p.1~34, Macmillan Company, London, 1970

第一章 药物的来源和制剂

目的要求

1. 了解药物的来源和植物药的主要有效成分。
2. 熟悉制剂的意义及其类型。

第一节 药物的来源

人们一方面利用自然界中现成的物质供药用，同时也将自然界中的物质加以改造后供药用。因此，药物就其来源来说，大致可分为天然产品与人工合成产品两大类^[1]。

一、天然产品 (Natural products)

(一) 植物药 如大黄、甘草、黄连、麻黄、罂粟壳等。

(二) 矿物药 如硫酸镁、氯化钠、卤碱、芒硝等。

(三) 动物药 如肝脏、甲状腺、乌贼骨、鱼肝油等。

中草药主要是植物药，资源极其丰富，是个取之不尽，用之不竭的天然宝库。不少精品如阿托品、黄连素、麻黄碱、吗啡等就是从天然产品中提取出来的有效成分。抗生素类原来都是天然产品，后来采用微生物培养方法，进行大规模的生产。有许多天然产物的有效成分已能人工合成，并加以结构上的改造提高效力。常用抗生素我国都能大量生产供应，并能创制国外没有的抗生素，例如创新霉素就是我国新发现的一种抗生素。

二、人工合成产品 (Synthetic products)

人工合成产品是用化学合成的方法制得的药物，例如磺胺类、巴比妥类、普鲁卡因、度冷丁、阿司匹林等等。人工合成药种类繁多，临床应用极为广泛，已大大超过天然药物的品种。原来属于天然产品的药物，包括结构复杂的药物如维生素、甾体激素，也能用人工合成的方法进行生产，并采用改变化学结构方法，合成许多效力更佳的新药。此外，还可利用生物合成的方法，生产更有特效的新产品，如半合成的新青霉素类等等。

在发掘中草药和寻找新药中，应努力创制具有“三效”（高效、速效、长效）、“三小”（毒性小、用量小、成本小）和“五方便”（生产、运输、使用、携带、保管）的药物。这对加强战备，改善我军的医药装备具有重大意义。

第二节 植物药的有效成分^[2]

植物药的种类甚多，应用甚广，其成分复杂，许多重要植物药的有效成分为生物碱（如

吗啡、阿托品、麻黄硷、黄连素、奎宁、依米丁等），有些为甙（如洋地黄毒甙、黄夹甙、大黄甙等）。此外，还有挥发油、有机酸等。它们的一般特点分述如下：

一、**生物碱**（Alkaloid）是含氮的有机碱，味苦，较小的剂量往往就能产生显著的药理作用。**游离生物碱**呈碱性反应，一般难溶于水易溶于有机溶剂中。与酸化合变成**生物碱盐类**（如盐酸吗啡、硫酸阿托品等）后，则易溶于水而难溶于有机溶剂中。根据这种性能，在碱化条件下，可利用有机溶剂（如醇、醚、氯仿等）来提取植物药中的生物碱；将生物碱加酸变为生物碱盐，可制成水溶性制剂（如注射剂）。军医理解了生物碱溶解度的特点，在处方时应避免生物碱盐类溶液与碱性物质配伍，以防止沉淀而不利应用。

二、**甙**（Glucoside）亦称**配糖体**，其分子结构是由糖与**甙元**（或称配基）两部分组成，它的药理作用主要由甙元决定，糖的部分只影响其溶解度、作用强度和作用持续的时间等（如强心甙类）。甙一般呈中性或弱酸性反应，大多能溶解于水或醇中。久置或在酸、碱、酶等的影响下易于水解而失效。

皂甙（或称皂硷体 Saponin）是另一特殊类型的配糖体，能溶于水，振荡时产生泡沫，有乳化作用，能使红细胞溶解。口服不吸收，对胃肠道有刺激，可反射地引起恶心、呕吐与祛痰等效应。远志、桔梗都含有之。

黄酮化合物（Flavonoid）及其甙类 近年来在研究防治慢性气管炎的药物中引起国内外科学工作者的重视。其基本化构中大多含有2-苯基色酮，作用极为广泛，如具有镇咳、祛痰的映山红，防治肝炎、降低血脂的水飞蓟，防治冠心病的葛根素等。

三、**其他** 植物药除以上这些成分外，尚有中性物质（如山道年）、有机酸（如水杨酸）、挥发油（如薄荷油）、固定油（如蓖麻油）、鞣酸、树胶等成分，亦可作为药用。

第三节 药物的制剂^{[2][3]}

从各种来源获得的原料药物，不论它是生药（药材）、或是化学纯品，都必须加工做成制剂才便于应用和更好地发挥疗效。自中草药制成制剂的意义更大，通过制药学的技术操作，提取其中的有效成分（精华），除去其中的无用或有害物质（糟粕），使它不仅缩小容积、减轻重量、提高疗效、减少毒性，也便于应用、携带和运输，这对于部队用药来说更为重要，也是发掘、提高和更好地利用中草药的途径之一。下面简介临床常用的几种制剂。

为了遵循药典的规定，本讲义介绍的“制剂”（Preparations）一律采用拉丁名称。各论正文中叙述的药物以中文名称为主，同时介绍英文名称，以便处方时参考应用。

一、液体剂型（Liquid form）

煎剂 Decoctum 亦称汤药。是生药和水煎熬后而得的煎出液，久置易霉，须于临用前新鲜制备。这是祖国医学几千年来最常用的一种剂型，普通是把一剂中药煎熬两次，作为一日量，分两次服。

溶液剂 Solutio 或Liquor 是非挥发性药物的水溶液，其溶质多为结晶性药物，如10%葡萄糖溶液，就是在100毫升的溶液中含有10克结晶性葡萄糖。

注射剂 Injectio 是专供注射用的灭菌澄明溶液。少量注射液固封于安瓶中的叫**安瓿剂** Ampulla（少数油剂或混悬液也以安瓿剂供应）。在溶液中不稳定的药品（如青霉素）则以干燥粉末，封装于安瓿或小瓶中制成**粉针剂**供应，临用前以注射用水配成新鲜的注射液应用。

糖浆剂 Syrupus 是含有有效药物的浓蔗糖溶液，减弱药物的苦味。

合剂 Mistura 是多种药物组成的混合液体。有沉淀的合剂，应用前必须摇匀。

酊剂 Tinctura 是将生药用适当浓度的乙醇浸出后再经浓缩制成的制剂。一般生药的酊剂浓度为20~50%；剧、毒药物的酊剂浓度最多不超过10%（即10克生药制成100毫升的酊剂）。化学纯品亦可溶于乙醇制成酊剂，如碘酊。挥发性药物的醇溶液制剂叫**酊剂** Spiritus，如樟脑酊。

流浸膏 Extractum Liquidum 一般是用适当的溶剂（如乙醇或其他有机溶剂）将生药中可溶成分浸出后过滤，再将滤液蒸发、浓缩至每100毫升相当于生药100克为度。如继续蒸发除去其中的溶剂和水分，使成半固体或固体，称为**浸膏** Extractum。

冲服剂 Granulae 是近年来我国在煎剂和糖浆剂的基础上发展起来的一种中药新剂型。一般系将中草药煎熬或提炼成稠浸膏后制成的颗粒状散剂，分装在塑料袋内，临用时用开水冲化成液体剂型服用。这种剂型节省煎药时间，携带方便。

搽剂 Linimentum 是刺激性药物的油制剂或醇制剂，如松节油搽剂，专供外用，不作内服。

洗剂 Lotio 是把无刺激性、不溶解的药粉和水作成的混悬剂，对于急性发炎的皮肤有保护、散热和消炎作用，如炉甘石洗剂，用前摇匀。

二、软性剂型（Semisolid form）

软膏 Unguentum 包含有效成分和基质两部分，常用的基质为凡士林，也可用羊毛脂或豚脂（即猪油）。粉质药物含量较多的软膏叫**糊剂** Pasta，如氧化锌糊剂，含氧化锌25%以上。

眼膏 Oculentum 是专供眼科用的灭菌软膏，必须细腻、不含粗粒物质，以免机械刺激伤害眼睛。

硬膏 Emplastrum 是涂在布片或纸片上的硬质膏药，遇体温则软化而具有粘性。常用的硬膏如胶布作包扎用。此外，还有含有各种中药的**膏药**。

栓剂 Suppositorium, Supp. 是供塞入身体不同腔道使用的一种软性剂型。重量和形状因用途不同而有差别。肛门栓剂呈圆锥形，重约2g；阴道栓剂呈球形或卵形，重约5g。其基质的熔点须要接近体温，这样在室温时可以保持固体状态，但塞入体腔后就能熔化而发挥治疗作用。柯柯豆脂和甘油明胶符合这种要求。

三、固体剂型（Solid form）

片剂 Tabella 是把一定量的药粉，加上稀释剂（如淀粉、乳糖）、粘合剂（如糖浆、胶浆溶液）、崩解剂（如白陶土、天然海绵）等制成颗粒后，利用压片机轧成的小片，其优点是剂量准确、便于服用、易于携带和配发。能完整地通过胃而到肠部才崩解的片剂称**肠溶片剂**（Enteric coated tablet）。

薄型片 Films 是用羧甲基纤维素胺制成的薄膜状基质小片，只能吸附少量的强效药物，特别是那些能在舌下吸收后达到速效、强效的药物最好制成薄型片，如喘息定、硫酸阿托品等。这种新剂型具有体积小、轻、包装严密，适于战备。

散剂 Pulvis 亦称**粉剂**，有外用和内服两种，易于潮解的药物一般不作散剂供应。外用散剂（又称**撒粉**）颗粒要求细腻，以增加接触面积和避免粗大颗粒的机械刺激。内服散剂通常用纸分包供应。

胶囊剂 Capsula 如果药粉有刺激性或苦味，可装入胶囊中，便于口服。另有一种特制**胶囊**，经胃到肠遇到碱性肠液才溶化，此种**胶囊剂**称为**肠胶囊剂**，可以避免胃液对药物的破坏作用。

第四节 药典^[3] Pharmacopoeia

药典是由政府颁布的有关药品标准的法规文件。收载本国比较常用而有一定疗效的医疗和预防用的药品、制剂。并规定其标准规格和检验方法，作为药品生产、供应、使用和管理的依据。从事医药卫生人员必须严格遵守。药典的内容应随医药卫生事业的发展而进行修订。凡药典内收载的药品称为**法定药品**（Official drugs），未收载的药品称为**非法定药品**（Nonofficial drugs）。

我国在公元659年颁布的《唐新本草》是世界上第一部药典。1930年国民党反动政府也颁布过一部《中华药典》，其内容几乎全部是从英美药典抄来的，编成后经过近二十年未加修订。中华人民共和国成立后，在1953年就出版了《中华人民共和国药典》，简称《中国药典》，至1957年又公布了增补本。1963年重新编订，分一、二两部，“一部”收载中药446种及中药成方制剂197种，“二部”收载化学药品、抗生素、生物制品等各类药品及制剂667种。

1977年我国又颁布了《中华人民共和国药典》最新版。新药典仍分为一部和二部。一部收载中草药材、中草药提取物、植物油脂、生药以及它们的单味制剂、中成药和复方制剂。二部收载化学药品、抗生素、医用同位素、生物制品及其制剂。两部都有正文与附录。一部正文收载各类药品和制剂1152种，二部正文收载773种，合计1925种。与63年版药典比较，作了充实与改进。一部附录还规定了中草药检定通则、中草药炮制通则、中草药与成方显微鉴别法。二部附录作了较大修改，增加了许多检定药品质量的方法。由于我国加速实现四个现代化，医药工业必将会迅速的发展，保障人民健康的药品种类逐渐增多，这就要求药典及时

加以修订以适应发展的需要。

此外，卫生部和医药管理总局为了明确防病与治病和计划生育所必需的、疗效确实、安全可靠的药品制剂，于1981年8月公布了《国家基本药物目录》，允许投入市场，供医药人员选用。

1984年9月20日第六届全国人民代表大会常务委员会第七次会议通过的中华人民共和国药品管理法，自1985年7月1日起施行。药品管理法的公布，标志着我国药品管理工作进入了法制化的新阶段，为加强药品监督管理，保证药品质量，增进药品疗效，保障人民用药安全，维护人民健康，提供了法律保证，充分体现了国家对人民群众健康的重视和关怀。药品管理法共十一章，内容见附录。

复习思考题

1. 药物的来源有哪几类？植物药的主要成分有哪些？了解生物硷和生物硷盐的溶解度有何实际意义？
2. 原料药物做成制剂的目的何在？哪些制剂最适于部队使用？为什么？
3. 什么叫做药典？制订药典的目的何在？

参考文献

1. 张毅：现代药理学的发展，《药理学》，第一版，p.5~7，人民卫生出版社，北京，1959
2. 张昌绍：植物药的成份和药物的制剂，《药理学》，第三版 p.7~9，人民卫生出版社，北京，1965
3. 谭世杰：药典与制剂，《药理学》，p.19~22，第二军医大学训练部器材供应处，1957

第二章 药效动力学

Pharmacodynamics

目的要求

1. 以唯物辩证法的观点认识药物与机体相互作用的基本规律。
2. 了解药物作用的基本类型、药物作用的两重性和药物作用的选择性。
3. 掌握一些专用名词术语的确切含义。

第一节 药物的作用

药效动力学 (Pharmacodynamics)^{[1][2]} 是指药物对生活机体产生的影响或生活机体对药物产生的反应而言,大多数药物的作用表现为增强、减弱或维持生活机体固有的生理或生化功能。严格地说药物作用 (Drug action) 是指药物与机体组织之间的 **始初作用**。药物作用所引起机体组织在功能上或形态上的改变称为 **药物效应** (Drug effect)。例如利尿药的作用在于抑制肾小管再吸收氯化钠,其效应是排钠利尿、消除水肿、减少血容量与降低血压。但是在药理学文献中,常把药物作用和药物效应当作同义语,互相通用。

一、药物作用的基本类型

(一) **兴奋作用和抑制作用** 药物对机体的作用是多种多样的,大多数药物都能使正常或病态组织器官发生功能活动上的改变。如腺体分泌、肌肉收缩、神经冲动的传导等都能被药物所影响。凡能使机体功能活动增强的作用称为 **兴奋作用** (Stimulation), 凡能使机体功能活动减弱的作用称为 **抑制作用** (Depression), 从过高水平降至正常者称为 **镇静**, 功能活动停止不易恢复者称为 **麻痹**。药物兴奋作用与抑制作用,在一定条件下可以互相转化。例如应用中枢兴奋药时,剂量过大可引起过度兴奋而发生惊厥,进而由于耗能过甚可转化为中枢抑制,甚至麻痹,局部麻醉药普鲁卡因少量吸收后对中枢轻度抑制表现为镇静,但大量吸收引起中毒时则可表现为兴奋性反应——惊厥。

(二) **局部作用和吸收作用** 药物未吸收入血液之前在用药部位所出现的作用称为 **局部作用** (Local action), 如在手术局部注射盐酸普鲁卡因后产生局部麻醉作用。当药物被吸收入血流以后所表现的作用称为 **吸收作用或全身作用** (Absorption action or general action), 如应用巴比妥类药物后产生的镇静、催眠等作用。

(三) **直接作用和间接作用** (原发作用与继发作用) 药物对窗所接触的组织或器官直

接产生的作用称为**直接作用** (Direct action)，而由这种直接作用所引起的其它组织器官的效应称为**间接作用** (Indirect action)。例如昏倒的病人吸入氨剂，氨剂刺激呼吸道粘膜是直接作用，但由于刺激了呼吸道粘膜的感觉神经末梢，反射地兴奋中枢神经系统促使病人苏醒，这就出现了间接作用 (**通过神经联系**)；给病人注射促肾上腺皮质激素，促使肾上腺皮质增加分泌是直接作用，由于肾上腺皮质激素的增加，引起糖和蛋白质等物质代谢的改变，则是间接作用 (**通过体液传递**)；洋地黄应用于心力衰竭伴有水肿的病人，出现心肌收缩力增强是直接作用，由于心肌收缩力增强，促使循环的改善而出现利尿作用和消除水肿，则是间接作用 (**通过功能的改善**)；给感染发热的病人应用某种抗菌药物后，致病菌的繁殖和生存受到抑制，这是直接作用，由于致病的细菌受到抑制，致热物质释放减少，使发热减退，则是间接作用 (**通过其他因果关系**)。从上面所举例子来看，直接作用即原发性的药理作用或**原发作用** (Primary action)，而间接作用则是继发性的药理作用或**继发作用** (Secondary action)。所以必须从事物发展过程中的互相联系及互相影响来分析药物的作用。

二、药物作用的选择性

机体各种不同组织和细胞，相互之间不仅有形态上和功能上的不同，而且生化过程也各有其不同的特点，也就是说它们之间既有相同之处，又有差别之点。近年来分子药理学的进展，揭示了药物作用的本质，主要以不同的方式影响组织细胞生化过程，这就决定了机体不同组织器官对药物敏感性的差异性。当药物吸收后与机体组织器官接触时，并不是对所有组织都发生同等强度的作用。大多数药物在适当剂量时只对某些组织或器官发生明显作用，而对其它组织或器官则作用很小或几无作用。这就反映了某些组织器官对药物的敏感性高，显示出**药物作用的选择性** (Selectivity)。例如强心甙类药物洋地黄，当应用一般治疗剂量时，对机体大多数组织的作用不明显或无作用，但却对心脏具有选择性的强心作用；又如化学治疗药物对微生物或寄生虫有明显的选择作用，故能发挥良好的防治效果，而对宿主无害或影响较小。但是也有些药物在一般治疗剂量时就对机体多种组织器官产生明显的作用，显示出药物作用的选择性低，亦可称为**药物作用的多面性**。例如拟肾上腺素类药物肾上腺素在治疗剂量时，可产生兴奋心脏、升高血压、松弛支气管平滑肌等作用。所以由于药物选择作用低，在临床应用时往往出现与治疗作用无关的副作用。

产生药物选择作用的基础有三^[3]：

(一) **药物分布的不同** 药物必须以适当的浓度到达作用部位才能产生效应。药物在体内的分布取决于机体组织对药物的亲和力，亲和力大的则浓度高，反之则浓度低，而且对药物敏感的组织，能在比较低的药物浓度下就能产生反应。因此，药物的分布与其选择作用有密切关系。例如，口服放射性碘后短时间内约80%蓄积在甲状腺内，加之甲状腺细胞需利用碘制造甲状腺激素，故碘对甲状腺有选择作用，可用于诊断或治疗甲状腺疾病。但是，也有许多药物，由于机体对外源性物质要进行处理，可能分布在肝、肾等组织中的浓度很高。但这些内脏组织细胞对药物并非敏感，故没有明显的选择作用，很可能还表现其毒性作用。

(二) **生化机能的不同** 不同种属的生物或同一种属生物的不同组织，其生化机能存在