

GUOJIA
FEICHUFANGYAO
JIATINGYINGYONG
ZHINAN

国家非处方药
家庭应用指南
(修订本)

本书为配合1999年我国卫生部、国家药品监督管理局颁布的《国家非处方药目录》的实施而编写。读者定位主要面向广大的消费群，旨在为自我药时选药和用药进行指导，同时也为药房、药店执业药师提供参考。本书分上、下两篇，上篇收载西药活性成分121种、限复方制剂的活性成分25种、复方制剂19种，下篇收载中成药160种。由我国著名医药学家、国家非处方药办公室药物遴选专家编著，具有权威性。



张石革 孙定人 主编
广东人民出版社

国家非处方药 家庭应用指南

(修订本)

张石革 孙定人 主编

广东人民出版社出版发行

广东省新华书店经销

肇庆新华印刷有限公司印刷

(厂址：肇庆市狮岗)

850×1168 毫米 32 开本 17.75 印张 1 插页 380,000 字

1999 年 8 月第 1 版

2000 年 1 月第 2 版 2000 年 8 月第 3 次印刷

ISBN 7-218-03096-3/R · 65

定价：29.80 元

如发现印装质量问题，影响阅读，请与承印厂联系调换。

售书热线：(020) 83791084 83790667

主 审 金有豫
主 编 张石革 孙定人
副主编 孙路路 彦 玲 徐小薇
编 委 孙路路 (铁道部北京医院)
赵志刚 (北京天坛医院)
宋 菲 (北京积水潭医院)
沈 素 (北京友谊医院)
林 阳 (北京安贞医院)
修赤英 (北京同仁医院)
娄吕宁 (铁道部北京医院)
彦 玲 (北京二龙路医院)
郝红兵 (北京安定医院)
徐小薇 (医科院北京协和医院)

100305

编者的话

1951年，美国国会通过了由一位药师参议员提出的对“食品药品化妆品法”的修正案（杜哈姆修正案，Durham Hemphrey Amendment To The Food Drug Cosmetic Act），规定了处方药与非处方药的分类标准，在世界上第一个创建了药品按处方药与非处方药分类管理制度。

此后日本在1967年，英国在1968年，德国和加拿大在1972年分别通过了有关法律，相继建立了药品的分类管理体制。迄今为止，世界大多数发达国家（如美、英、德、日、法、瑞士、加拿大等）和部分发展中国家（如巴西、波兰、新加坡、韩国等）已普遍采用。我国的香港、澳门和台湾地区也采纳了这一分类管理，建立了处方药与非处方药分类管理制度和相应的法规体系。

非处方药，是相对于处方药的一个名称。顾名思义，即是不用医生诊断和开写处方，消费者依据自己所掌握的医药知识，并借助阅读药品标识物，对小伤小病自我诊疗和选择应用的药品。在美国称之为“可在柜台上买到的药物”（Over The Counter），简称OTC，这一称谓已约定俗成，为世界各国所认知。

非处方药的由来源于两个方面：其一是消费者保健意识和消费观念的转变。小伤小病者为一些本可通过自我医疗即可解决的病症，而耗费大量的时间去医院排队看医生，造成医生付出大部分精力忙碌于小病，也使患者的医疗费用增加，这种情况让人感

到还不如自己到药店买药治疗来得经济和便捷。其二，自从“反应停”和“磺胺酏剂”等药源性疾病的不断发生（前者造成近万例新生儿肩部畸形——海豹肩；后者引起358人中毒，107人死亡），药物的安全性问题引起了全世界普遍关注，为了监控药品的安全性和减少其不良反应，各国也开始重视药品的分类管理。

此外，由于经济上的原因，各国也试图通过影响个人对自我健康负责，通过对易于诊断的小伤小病的自我治疗来减少公众对国家医疗资源的依赖性，减轻对公共保健支出的压力。

建立处方药与非处方药分类管理制度是一项复杂的系统工程，其影响涉及政治、经济、文化、资源、健康和传统观念等诸多方面。归纳起来表现在以下几点：

1. 沟通国际轨道

50年代以来，全球主要发达国家的福利支出日增，为减少医药费用的补贴，各国相继确立和实施了药品分类管理制度，不断缩减受补贴的药物名单，并加快处方药向非处方药的转换；加之联合国世界卫生组织（WHO）的倡导，药品分类管理制度也在发展中国家广泛实行，形成世界上的通用规范，并相应建立了非处方药国际组织和协会。我国开展此项工作后也能尽快贴近国际惯例，并与外部世界接轨，交流信息，广泛合作，共同发展。

2. 转换传统观念

健康是生命永久追寻的主题，长寿是人类共同的愿望。1978年联合国世界卫生组织（WHO）在原苏联阿拉木图召开“基本卫生保健国际会议”之后发表了“阿拉木图宣言”，提出了在2000年达到“人人享有卫生保健”的目标，认为其关键在于通过自我医疗来实现和享有基本卫生保健，并明确宣传每位公民都有义务对自己的健康负责，不要过分把健康看作基本人权而依赖社区和政府的“保护”，健康的责任应由政府、社会和个人三方共同承担。医院的昂贵诊费，无效的时空耗费，使小伤小病患者

无法承受。大多数人利用自己所掌握的医药知识，通过自我治疗和应用非处方药已获得满意的效果。“大病去医院，小病去药店”的观念正在悄然确立。

3. 减轻企业负担

伴随医疗设备的更新和药品的换代，医疗费用直线上升，自1978年以来年均增长率已达28.8%。另据统计：1992年国家为公费医疗所支付的医药费用总额达到373亿元人民币，占当年国家总支出的9.46%，1993年这一比例又增至9.64%。

另外，我国社会“老龄化”日益突出，人口比例虽小（约占人口总数的10%），但药品消费量大（占药品消费总量的30%~40%），“银发市场”极具潜力，相应的使企、事业公费医疗负担不堪承受，而非处方药则是摆脱上述困境的出路之一。

4. 促进医药生产

研制非处方药，将充分利用已失去专利保护期限的药物和活性成分，以组成新的配方和剂型，激发医药工业开发新药，尤其是开发新的不同组分、复方配方或改进剂型的积极性；为自我医疗提供安全有效、价格低廉、品种繁多的药品，参与市场竞争，满足人民需要。

5. 合理分配资源

庞大的医疗开支和公费医疗管理上的缺陷以及不尽规范的市场竞争，派生了形形色色的弊端，大处方、人情方、回扣风、浪费风已对社会发展产生了负效应。

目前，我国2~3级甲等医院的门诊患者中，小伤小病者约占半数，医生正在时时处理一大堆本来可以通过自我医疗就能解除症状的疾病。小伤小病通过使用非处方药得到治疗，不仅使医生集中精力，重点诊治疑难病例，同时也可缓解社会对医疗服务需求日益增长的压力。

6. 方便群众医疗

非处方药的特点简言以“安全、有效、稳定、方便”八个字而概之。安全、有效系指药品的作用确切，是经过数十年乃至近百年的时问在临床或实际应用中所验证的，其相对低毒、所致的不良反应机率较少；稳定是说药品的性质稳定，可以放置家庭贮存；而方便则包涵两个方面：一是非处方药的供药渠道广泛，不仅在医院，而且在药店、饭店、超市都可以买到；二是使用方便，不需借助特殊的器具，自己或依靠家人可完成给药。此外，非处方药品种众多，可以自我选择，价格也相对低廉。

非处方药对于我们并不陌生，对您和家人在生活中都曾是过去时。或许当您初患感冒或头痛时，会吃上一片止痛片；或许当膝盖不慎碰破时，自己会涂上一些紫药水；或许在出门远行时，提包里会放上一包乘晕宁。回顾中华民族的发展史，我国在传统的中医药上，问病吃药和保健防病渊远流长，《易经》中“君子思患而预防之”和《黄帝内经》中“君子不治已病治未病”都佐证了这一习俗。五千年上下历程的疗病祛疾、繁衍生息也已证实了这一点。只不过是在世纪交接的前夕，我们以法律和专业的理论加以论述和界定而已。

九九归一，在21世纪即将莅临之际，传统的医药观念正在悄然地转变；首先是随着社会和经济的发展，健康已成为人类的头等大事；其后是药品的功能已由治病救命转变到借以提高人们或由他们组成的生活质量。正像阳光、空气和雨露一样，非处方药是人类健康的朋友。我们由衷地企盼，这部专著，能经常伴随您的左右，护卫着您的健康。

编写说明

本书是为配合 1999 年由我国卫生部、国家药品监督管理局颁布的《国家非处方药目录》的实施而编写的。读者定位主要面向广大的消费人群，旨在为自我药疗时选药和用药进行指导，同时也为药房、药店和超市的执业药师在接受咨询和答疑时提供参考。

本书依据《国家非处方药目录》（第一批）名单编写，分为上、下两篇，上篇收载西药活性成分 121 种，限复方制剂的活性成分 25 种，复方制剂 19 种；下篇收载中成药 160 种。介绍每一种药物的名称、体内过程、药物作用、适应症状、不良反应、注意事项、用法与用量等项。为便于读者查阅，现将编写原则和内容说明如下：

1. 处方药与非处方药

处方药（Prescription Drug）是治疗借助于诊断手段（光、电、核、声仪器或血、尿、粪、组织的生化分析）来确诊的疾病，并由医生开写处方，用于专属性强、病情严重而又需要医药人员监督指导使用的药品；而非处方药（Nonprescription Drug；Over The Counter）则是用于由消费者自我认识和辨别的症状，并且能够自己治疗，或借助于阅读药物标识物或咨询药师后使用的药品。两类药品各有其适应指征，尽管组分为同一活性成分。例如非甾体抗炎药物布洛芬，治疗类风湿性关节炎、滑膜炎、强直性脊柱炎、痛风等疾病则是处方药的适应证；而用于控制头痛、

牙痛、发烧、痛经等症状则是非处方药的适用范围。两者的剂量、用药持续时间、剂型规格、品牌和药品标识物也不尽相同，但彼此可以相互转换。

当然，一些已明确诊断的慢性疾病的维持治疗，在患者久用熟知的情况下，也属于非处方药的范畴。例如治疗 I 型糖尿病的胰岛素，患者也可适时适量地自我给药。

2. 自我医疗与非处方药

自我医疗（Self-Medication）是伴随全球科技、文化和经济的发展而兴起的一项自发性运动，其核心是个人应对自己的健康负责。世界卫生组织（WHO）在 1970 年召开的“国际初级卫生保健会议”上指出：人们有权利也有责任以个体或集体的方式参与他们卫生保健的计划和实施。

自我护理、自我保健、自我药疗是构成自我医疗的三大支柱。而后的正确表述是指在没有医生或其他医务工作者指导的情况下，恰当地使用非处方药，用于缓解轻度和短期的症状及不适，或者用于治疗轻微的疾病。因此可以说，非处方药是成功的自我医疗的基础。

3. 活性成分与制剂

活性成分（Activity Composition）系指具有药理活性、安全有效、结构明确、质量可控、来源充足的化学单体（天然和合成）。或者更确切地说，这些成分在临床应用已证实其安全性好，又不受专利和新药行政保护，并用于缓解或治疗一些适应症。因此，从某种意义上讲，组成非处方药的活性成分实际上是一些“老药”。

制剂（Preparation）是应用制药工艺和配以辅料，将活性成分制成适用于人体使用的各种剂型（如片剂、胶囊剂、散剂、冲剂和软膏剂等）。分为单方或复方制剂，单方的主要成分是一种，复方则是有两种或两种以上成分以不同配比组成的制剂。

本书编写以活性成分为框架，除 19 种目录中所颁布的制剂外，可供选用的上市制剂仅是我们推荐于消费者选用的品种，它最终的定性尚有待于依据国家颁布的有关法规，由生产厂商进行申报，经审核批准后作为非处方药。

4. 药物作用与不良反应

药物与其他任何事物一样，都具有双重性，即疗效（Therapeutic Effect）及引起人体生理生化紊乱和危害人体器官功能的不良反应（Adverse Reaction）并存。非处方药虽然低毒、安全，并经过医药专家的遴选和国家的审定，但药物本身所具有的双重性难以逾越！这一点应引以为戒。

本书详实地描述了药物作用和不良反应，尤以后者的笔墨较重，目的在于提醒读者注意并权衡利弊。

5. 药物过量与处理

药物是“量变到质变”定论的最典型物质。药即是毒，毒就是药，它的限定在于剂量。适当的剂量可以解除症状；过量或致死量可以引起中毒乃至死亡。但药物过量是大家不愿意看到的，它源于误服、用药不当或人为的自残。

本书介绍了药物过量后的发生症状和简单处理措施，但愿这是多余的赘述，一旦发生，最好是及时送至医院。

6. 本书编写原则兼具科学性、实用性和通俗性

“专业”和“业余”的确存有一定的屏障。为便于沟通，一是文字上尽量通俗易懂；二是对部分药物专用名词进行了解释，力求两者的融会贯通。

如前所述，非处方药对于我们还是一项新生事物，对它的理解、完善与发展还有待于时间的推移，也有待于我们共同的努力，包括作者和读者。

药物专用名词的解释

对本书中所出现的与药物应用相关的专用名词予以解释，为读者在自我药疗时提供参考。

药品 (Drug) 药品是人类不可缺少的生活消费品，是“药物”和“药材”两个概念的统称。药品是指用于预防、治疗、诊断人的疾病，有目的地调节人体的生理机能并规定有适应证、用法和用量的物质，包括中药材、中药饮片、中成药、化学原料药及其制剂、抗生素、生物制品、放射性药品、血清疫苗、血液制品和诊断药品等。

麻醉药品 (Habitforming Drug) 系指连续使用后易产生身体依赖性、能成瘾癖的药品，使用和贮存应严格管理。

毒性药品 (Toxic Drug) 系指毒性剧烈，治疗剂量与中毒剂量相近，使用不当致人中毒或死亡的药品。贮存、使用应严格控制。

精神药品 (Spirit Drug) 直接作用于中枢神经系统，使之兴奋或抑制，连续使用可以产生依赖性的药品，并依据对人体产生依赖性和危害人体健康的程度，分为第一类和第二类。贮存、使用应认真管理，严禁滥用。

抗生素 (Antibiotic) 系指由细菌、真菌或其他微生物在生长过程中产生具有杀灭和抑制病原体的微生物产物，或使用化学方法半合成的衍生物和全合成的仿制品。其具有效价和使用期限，对自然环境依据各药的理化性质有特殊的限定。

中成药 (Traditional Chinese Medicine Patent Prescription)

中成药是以中草药为原料，经制剂加工制成各种不同剂型的中药制品，包括丸、散、膏、丹各种剂型。是我国历代医药学家经过千百年医疗实践创造、总结的有效方剂的精华。

新药 (New Drugs) 新药系指我国未生产过的药品。已生产的药品，凡增加新的适应证、改变给药途径和改变剂型的亦属于新药范围。我国新药的研究与生产按管理要求，中、西药各分为五类。新药经申请、检验、审评合格后，由国家药品监督管理局审核发给生产批准文号。

假药 (Bogus Drug) 按照《中华人民共和国药品管理法》规定，有下列情况之一的为假药：(1) 药品所含成分的名称与国家标准或省、自治区、直辖市药品标准规定不符合的；(2) 以非药品冒充药品或者以它种药品冒充此种药品的。有下列情形之一的药品按假药处置：①国务院卫生行政部门规定禁止使用的；②未取得批准文号生产的；③变质不能药用的；④被污染不能药用的。

劣药 (Drug of Inferior Quality) 按照《中华人民共和国药品管理法》规定，有下列情形之一的药品为劣药：①药品成分的含量与国家药品标准或省、自治区、直辖市药品标准规定不符合的；②超过有效期的；③其他不符合药品标准规定的。

毒性 (Toxicity) 系泛指药物或其他物质对人体的毒害作用。这种作用是潜在性的，与药物的剂量和疗程有关。使用小剂量和短疗程的药物，可以不显示毒性，而大剂量、长疗程用药，则因药物在体内蓄积或其毒性的累积则可显示毒性反应，造成人体功能障碍或器质性损害。一般地说，停止用药并进行治疗，毒性反应可逐渐消退。但有的药物毒性可迁延很久，甚至停药后毒性反应继续发展，造成严重后果。

耐受性 (Tolerance) 指药物连续多次应用于人体，其效应

逐渐减弱，必须不断地增加用量才能达到原来的效应。耐受性是药物治疗中的一种常见现象，其发生的机理可因药物性质的不同而异。例如，苯巴比妥有药酶诱导作用，长期应用可致体内药酶活性提高，促使本身加速代谢，因此必须逐渐加大用量才能维持疗效。再如，连续使用吗啡，因体内吗啡样物质脑啡肽的产生受到抑制，因此需要应用更大量的吗啡，以补充脑啡肽产生的不足，用量就需不断增加。

耐药性 (Resistance to Drug) 又称抗药性，系指微生物、寄生虫以及肿瘤细胞对于化疗药物作用的耐受性，耐药性一旦产生，药物的化疗作用就明显下降。

耐药性根据其发生原因可分为获得耐药性和天然耐药性。自然界中的病原体，如细菌的某一株也可存在天然耐药性。当长期应用抗生素时，占多数的敏感菌株不断被杀灭，耐药菌株就大量繁殖，代替敏感菌株，而使细菌对该种药物的耐药率不断升高。目前认为后一种方式是产生耐药菌的主要原因。病原体对某种药物耐药后，对于结构近似或作用性质相同的药物也可显示耐药性，称之为交叉耐药 (Cross Resistance)，根据程度的不同，又有完全交叉耐药和部分交叉耐药之分。随着抗生素的应用日益广泛，细菌对一些常用的药物呈现不同程度的耐药性。对于那些应用时间越长，使用范围越广泛的药物，细菌的耐药性往往越严重。为了保持抗生素的有效性，应重视其合理使用。

药物作用 (Drug Effect) 指药物应用于人体后所引起机体在功能和形态上的改变。药物作用是在人体原有的生理生化机能和基础上产生的，主要有两种表示形式：兴奋或抑制。前者表示机能活动增强，后者表示机能活动减弱。

副作用 (Side Effects; Adverse Reactions) 也称副反应，系指应用药物时所出现的治疗目的以外的药理作用。一种药物常有多方面的作用，既有治疗目的的作用也并存有非治疗目的的作

用。如抗胆碱药阿托品，其作用涉及许多器官和系统，当应用于解除消化道痉挛时，除了可缓解胃肠疼痛外，常可抑制腺体分泌，出现口干、视力模糊、心悸、尿潴留等反应。后面这些作用是属于治疗目的以外的，且可引起一定的不适或痛苦，因此称为副作用。副作用和治疗作用在一定条件下是可以转化的，治疗目的的不同，也导致副作用的概念上的转变。如在手术前为了抑制腺体分泌和排尿，阿托品的上述副作用又转化为治疗作用了。副作用常为一过性的，随治疗作用的消失而消失。但是有时候也可引起后遗症。

适应症状 (Indication Symptom) 指适合于某种药物的疾病或症候。非处方药的适应症状主要是一些轻度和短期的症状及不适，或轻微的疾病和已经确诊的慢性疾病的维持治疗。

药品不良反应 (Adverse Drug Reaction; ADR) 系指药品按正常用量及正常用法应用于人体所出现的使用目的以外的不利于病人的反应。不良反应主要由于药物本身所引起，但也有质量、剂型、使用方法等因素。按照发生的机制，不良反应分为A、B两大类。A类反应：又称与剂量相关的不良反应 (Dose-dependent ADR)，是药物常规作用的延伸和发展，其发生与剂量——效应曲线相符合，因此是可预报的 (Predictable)。A类反应又可进一步分为过度作用、副作用、毒性和首剂效应等。此外，尚有继发反应和停药反应，属于A类有关的不良反应。B类反应：又称与剂量无关的不良反应 (Dose-independent ADR)。其特点是：①与常规的药理作用无关；②反应的发生与常规剂量无关，因此属于不可预报的不良反应 (Non-predictable ADR)。B类反应包括遗传药理学不良反应和变态反应两类。除此以外，药物所致的依赖性以及药物的致癌 (Carcinogenesis)、致畸 (Teratogenesis) 也属于不良反应的研究内容。

停药反应 (Withdrawal Reaction) 又称撤药综合征，系指

骤然停用某种药物而引起的不良反应。长期连续使用某些药物，可使人体对药物的存在产生适应。骤然停药，人体不适应此种变化，就可能发生停药反应，主要表现是症状反跳（Rebound）。例如长期应用肾上腺皮质激素者，由于脑垂体前叶促皮质素的释放受抑制，骤然停药可表现皮质激素不足的反应。一些血管扩张药，如硝酸甘油、曲克芦丁的骤然停用，可造成反跳性血管收缩而致心绞痛发作。很多起调整机体功能作用的药物都可致本类不良反应。长期应用可致停药反应的药物后，应采取逐渐减量的办法来过渡而达到完全停药的目的，以免发生意外。

变态反应 (Allergic Reaction) 系指经变应原致敏的人体再次接受相同的变应原刺激后产生异常免疫反应，引起人体功能或组织的损伤。许多药物都可引起变态反应。高分子药物可直接作为变应原引起反应，低分子药物本身无变应原性质，但药物或其他代谢产物可作为半抗原与人体蛋白结合而成变应原而致变态反应。变态反应可表现出各式各样的症状，如各种形态的皮疹和皮肤损伤、哮喘、喉头水肿、血细胞减少、溶血性贫血、肾炎、关节炎、脉管炎、血清病、红斑性狼疮、结肠炎及其他消化道症状，乃至过敏性休克等。发生反应后，应停用致敏药物并进行抗过敏和对症治疗。对致敏药物应予确认，尽可能避免再次接触应用。

药物过敏性休克·(Shock Caused by Drug Sensitiveness) 系指由于患者对某些药过敏，接触或使用这些药物后，引起的过敏性休克。常见于青霉素类，也可见于头孢菌素类、氨基糖苷类、生物制品、酶类、右旋糖酐、含碘造影药、天花粉、维生素 B₁、普鲁卡因等药物。其他许多药物也偶可致过敏性休克。临床表现主要有：①呼吸道阻塞症状：由喉头水肿、支气管痉挛及肺水肿所引起。表现为胸闷、心悸、喉头堵塞感、呼吸困难、脸色涨红等，伴有濒危感、口干、头昏、面部及四肢麻木。②微循环障

碍：表现为面部苍白、烦躁不安、畏寒、冒冷汗、脉搏微弱及血压下降等。③中枢缺氧症状：表现为意识丧失、昏迷、抽搐、大小便失禁等。④皮肤过敏症状：可能伴瘙痒、荨麻疹及其他皮疹。防止过敏性休克发生，必须在用药前了解患者及有关家属的药物过敏史，必要时可进行药物皮试。遇有过敏性休克发生时，应立即：①使患者卧床，采取足高头低位，解开衣带，保温并保持安静；②吸氧并保持气道畅通，必要时行气管插管或切开；③注射肾上腺素；④应用抗过敏药物（肾上腺皮质激素）；⑤纠正酸中毒；⑥注射钙盐；⑦其他对症措施。以上一些措施适用于青霉素或其他药物所致的过敏性休克。

禁忌证 (Contraindication) 是相对于适应证的反义词，指药物不适宜应用于某些疾病、情况或特定的人群。或应用后反而会引起不良后果，在具体给药上应予禁止或顾忌。

剂量 (Dose) 系指一次给药后产生药物治疗作用的数量。单位重量以千克 (kg)、克 (g)、毫克 (mg)、微克 (μ g) 等四级重量计量单位表示；容量以升 (l)、毫升 (ml) 两级计量单位表示。它们之间的关系是恒定的，即 1 千克 (kg) = 1000 克 (g)，1 克 (g) = 1000 毫克 (mg)，1 毫克 (mg) = 1000 微克 (μ g)；1 升 (l) = 1000 毫升 (ml)。

但有一部分抗生素、激素、维生素及抗毒素，由于效价不恒定，只能靠生物鉴定的方法与标准品比较来测定，因此，采用特定的“单位” (unit, u) 剂量。

生物利用度 (Bioavailability) 系指药物剂型以各种给药方式应用后能被吸收进入人体血液循环的药物相对分数及速度，一般用吸收百分率表示。

药物的体内过程 (Intracorporeal Course of Drug) 处置即指药物从进入人体后，作用于各组织和器官，产生一系列相应的药物作用。同时人体也对药物进行一系列的生理处置过程，主要包

括吸收、分布、代谢、消除等主要环节，其中吸收、分布、排泄等三个过程统称为药物转运，而药物在体内依靠酶的作用发生化学变化成为新物质的过程称为转化或代谢。由转运和转化组成药物在体内的全部过程。两种变化往往结合进行，即药物在体内转运的同时发生转化。了解药物的体内过程，对于掌握其性质、安排合理应用有重要作用。

药物代谢 (Drug Metabolism) 系指进入体内的药物经化学转化生成新物质的过程。药物代谢是依赖酶催化而进行的。不同的酶作用于不同的药物（基团），发生不同的反应，如氧化、还原、羟化、乙酰化、脱烃、脱卤、脱羟、磷酸化、核苷化、葡萄糖醛酸结合等。药物在体内经转化生成代谢物。一种药物可以有一种或多种代谢物。多数代谢物的活性较原形物为低甚至完全消失，需在体内转化为活性代谢物方起治疗作用，称为前体药物。人体内酶活性的变化和一些能影响酶活性的药物均能使药物代谢加速或受阻，从而影响药效。

首过效应 (First Pass Effect) 又称第一关卡效应。口服药物在胃肠道吸收后，经门静脉到肝脏，有些药物在通过粘膜及肝脏时极易代谢灭活，在第一次通过肝脏时大部分被破坏，进入血液循环的有效药量减少，药效降低，这种现象称为首过效应。

首剂效应 (First Dose Response) 系指首剂药物引起强烈效应的现象。有些药物，本身作用较强烈，首剂药物如按常量给予，可出现强烈的效应，致使患者不能耐受。如降压药可乐定，首剂按常量应用，常出现血压骤降现象。因此对于具有这种性质的药物，其用量应从小剂量开始，根据病情和耐受情况逐渐加大到一般治疗剂量，较为安全。

生物半衰期 (Biological Half Life) 简称血浆半衰期，系指药物自体内消除半量所需的时间，以符号 $T_{1/2}$ 表示。一般情况下，代谢快、排泄快的药物，其生物半衰期短，而代谢慢、排泄