

全国中等卫生学校试用教材

药 理 学

★（供中医士、放射医士专业用）

安徽科学技术出版社

本书曾于1979年11月由安徽人民出版社出版。现根据需要作第二次印刷，改由安徽科学技术出版社出版。

全国中等卫生学校试用教材

药 理 学

全国中等卫生学校试用教材

《药理学》编写组编

*

安徽科学技术出版社出版

安徽省新华书店发行

安徽新华印刷厂印刷

*

开本 787×1092 1/16 印张 13.75 字数 313,000

1979年11月第1版 1980年11月第2次印刷

印数 37,001—62,000

统一书号: K7200·2 定价: 1.12元

编写说明

本书是由卫生部、安徽省卫生厅组织有关高、中等医学院校医务人员共同编审的教材，供全国中等卫生学校三年制中医士专业和放射医士专业试用。

全书内容包括药理学理论和实验指导两部分。为保持本学科的系统性，对药理学内容作了比较系统的介绍，使用时可根据专业的需要和各地用药的具体情况，适当选择。关于中草药内容，因中医士专业开设了中草药学，放射医士专业较少应用，故很少收载。

参加编写的单位有：安徽省芜湖中医学校、合肥卫生学校，山东省临沂卫生学校，广西壮族自治区河池地区卫生学校。

本书由安徽医学院徐叔云副教授审稿。书中插图由安徽省滁县地区卫生学校绘制。

在初稿完成后，曾邀请全国部分高、中等医学院校的教师和人民医院的医药人员参加审稿会议，提出很多宝贵意见，谨致衷心感谢。

由于编者水平有限，编写时间仓促，缺点、错误在所难免。请各校师生在使用过程中及时提出批评指正，以便进一步修订提高。

全国中等卫生学校试用教材《药理学》编写组

1979年6月

目 录

第 一 章 总 论	(1)
第 一 节 绪 言	(1)
第 二 节 药物的作用	(1)
一、药物的基本作用	(1)
二、药物作用的类型	(2)
三、药物作用的机制	(3)
第 三 节 药物的体内过程	(3)
一、吸 收	(4)
二、分 布	(4)
三、代 谢	(4)
四、排 泄	(5)
第 四 节 影响药物作用的因素	(5)
一、药物方面的因素	(5)
二、机体方面的因素	(8)
第 二 章 麻 醉 药	(10)
第 一 节 全身麻醉药	(10)
一、吸入麻醉药	(10)
麻醉乙醚 (10) 三氟乙烷 (12)	
二、静脉麻醉药	(12)
硫喷妥钠 (12) 氯胺酮 (12)	
三、麻醉综合用药	(13)
第 二 节 局部麻醉药	(13)
一、局部麻醉药的作用	(13)
二、局部麻醉药的应用方法	(14)
三、常用的局部麻醉药	(14)
普鲁卡因 (14) 丁卡因 (15) 利多卡因 (15)	
第 三 章 镇静、催眠药和抗癫痫药	(16)
第 一 节 镇静、催眠药	(16)
巴比妥类作用	(16)
苯巴比妥 (18) 异戊巴比妥 (18) 速可巴比妥 (18)	
水合氯醛 (18) 导眠能 (18)	
第 二 节 抗癫痫药	(19)
苯妥英钠 (19) 扑癫酮 (19) 乙琥胺 (20)	

第 四 章 抗精神失常药	(21)
第 一 节 抗精神病药	(21)
氯丙嗪 (21) 奋乃静 (22) 氟奋乃静 (22) 三氟啦嗪 (23) 泰尔登 (23)	
第 二 节 抗焦虑药	(23)
安宁 (23) 安定 (23) 利眠宁 (24) 羟嗪 (24)	
第 五 章 镇痛药	(25)
吗啡 (25) 哌替啶 (26) 美散痛 (26) 延胡索乙素 (27) 颅通定 (27)	
芬太尼 (27)	
第 六 章 解热镇痛药及抗风湿药	(29)
乙酰水杨酸 (29) 水杨酸钠 (30) 非那西汀 (31) 对乙酰氨基酚 (31)	
氨基比林 (31) 安乃近 (31) 保泰松和羟基保泰松 (32) 甲灭酸 (32)	
氯灭酸 (32) 甲氯灭酸 (32) 消炎痛 (33) 炎痛静 (33) 解热镇痛药复方制剂 (33)	
第 七 章 中枢兴奋药	(35)
尼可刹米 (35) 洛贝林 (36) 回苏灵 (36) 咖啡因 (36) 美解眠 (36)	
第 八 章 主要作用于传出神经系统的药物	(38)
第 一 节 概 述	(38)
一、传出神经系统解剖学的分类	(38)
二、传出神经化学递质传递与分类	(38)
三、递质的代谢	(39)
四、效应器上的受体	(40)
五、传出神经药物的作用方式和分类	(42)
第 二 节 拟胆碱药	(43)
一、作用于 M 受体的拟胆碱药	(43)
毛果芸香碱 (43)	
二、胆碱酯酶抑制药	(43)
毒扁豆碱 (43) 新斯的明 (44) 吡啶斯的明 (44) 加兰他敏 (44)	
第 三 节 抗胆碱药和抗震颤麻痹药	(45)
一、节后抗胆碱药	(45)
阿托品 (45) 山莨菪碱 (47) 东莨菪碱 (47) 后马托品 (48) 溴化普鲁本辛 (48)	
胃疡平 (48) 苯纳嗪 (48) 胃安 (48)	
二、抗震颤麻痹药	(48)
左旋多巴 (48) 盐酸苯海索 (49)	
第 四 节 拟肾上腺素药	(49)
一、 α 和 β 受体兴奋药	(49)
肾上腺素 (49) 麻黄碱 (50) 去甲肾上腺素 (51) 3-羟酪胺 (51)	
间羟胺 (52) 甲苯丁胺 (52)	
二、 α 受体兴奋药	(52)

苯肾上腺素(52)	
三、 β 受体兴奋药	(53)
异丙肾上腺素(53)	
第五节 抗肾上腺素药	(54)
一、 α 受体阻断剂	(54)
苄唑啉(54) 苄胺唑啉(54) 苯苄胺(54)	
二、 β 受体阻断剂	(54)
心得安(54) 心得宁(55) 心得平(55)	
第九章 作用于心血管系统的药物	(57)
第一节 强心甙	(57)
洋地黄毒甙(61) 地高辛(61) 毛花丙甙(61) 毒毛旋花子甙K(61)	
黄夹甙(61)	
第二节 抗心律失常药	(61)
奎尼丁(61) 利多卡因(61) 苯妥英钠(62) 戊脉安(62)	
普鲁卡因胺(62)	
第三节 抗心绞痛药	(63)
亚硝酸类(63) 心可定(64) 潘生丁(64) 丹参(65)	
第四节 降血脂药	(65)
安妥明(65) 烟酸肌醇酯(65) 舒血宁(65) 消胆胺(66)	
第五节 抗高血压药	(66)
氯压定(67) 甲基多巴(67) 六烃季铵(67) 美加明(67)	
利血平(68) 胍乙啶(69) 肼苯哒嗪(69) 双肼苯哒嗪(69)	
地巴唑(69) 硝普钠(70)	
第十章 作用于血液与造血系统的药物	(71)
第一节 抗贫血药	(71)
铁剂(71) 叶酸(72) 维生素B ₁₂ (73)	
第二节 促进白细胞增生药	(73)
维生素B ₄ (73) 鲨肝醇(74) 白血生(74) 利血生(74)	
第三节 止血药	(74)
脑垂体后叶素(74) 安络血(75) 维生素K(76) 止血敏(76)	
对氨基苯甲酸(76) 6-氨基己酸(77) 止血环酸(77) 明胶海绵(77)	
第四节 抗凝血药	(77)
枸橼酸钠(77) 肝素(77) 双香豆素(78)	
第五节 调节水、电解质、酸碱平衡和血容量扩充药	(78)
一、补充水、电解质和热量的药物	(78)
等渗氯化钠注射液(78) 葡萄糖注射液(79) 氯化钾(79)	
二、纠正酸中毒的药物	(79)
碳酸氢钠(79) 乳酸钠(79)	
三、血容量扩充药	(80)
右旋糖酐(80) 低分子右旋糖酐(80) 缩合葡萄糖(80)	

第十一章 主要作用于呼吸系统的药物	(81)
第一节 祛痰药	(81)
氯化铵 (81) 溴己铵盐酸盐 (81) N—乙酰半胱氨酸 (81)	
第二节 镇咳药	(82)
可待因 (82) 咳必清 (82) 退嗽 (82)	
第三节 平喘药	(82)
氨茶碱 (83) 丙羟茶碱 (83) 色甘酸二钠 (84) 羟甲叔丁肾上腺素 (84)	
常用祛痰、镇咳、平喘复方制剂 (85)	
第十二章 作用于消化系统的药物	(86)
第一节 助消化药	(86)
稀盐酸 (86) 胃蛋白酶 (86) 胰酶 (86) 乳酶生 (86) 干酵母 (86)	
康胃素 (87)	
第二节 治疗消化性溃疡病药	(87)
一、抗酸药	(87)
碳酸氢钠 (87) 氢氧化铝 (87) 三硅酸镁 (87) 碳酸钙 (88) 氧化镁 (88)	
二、其他	(88)
硫糖铝 (88) 维生素U (89) 生胃酮 (89) H_2 —受体拮抗剂 (89)	
甲硫咪胺 (89) 甲氰咪胺 (89)	
第三节 止吐药	(90)
硫乙哌丙嗪 (89) 灭吐灵 (90)	
第四节 泻药与止泻药	(90)
一、泻药	(90)
硫酸镁 (90) 双醋酚汀 (91) 酚酞 (91) 开塞露 (91)	
二、止泻药	(91)
次碳酸铋 (91) 硅炭银 (91) 鞣酸蛋白 (91)	
第五节 利胆药	(92)
牛甘胆酸钠 (92) 去氢胆酸 (92) 胆维他 (92)	
第六节 治疗肝病辅助药	(92)
一、抗脂肪肝药.....	(92)
胆硷 (92) 肌醇 (92) 二氯醋酸二异丙胺 (93)	
二、促进肝脏解毒药	(93)
葡萄糖醛酸内酯 (93)	
三、降低血氨药	(93)
谷氨酸 (93) 精氨酸 (93) α —氨酪酸 (94)	
四、其他	(94)
维丙肝 (94) 肌甙 (94) 三磷酸腺苷 (94) 辅酶A (95) 细胞色素C (95)	
第十三章 利尿药和脱水药	(96)
第一节 利尿药	(96)
一、主要作用于髓袢升支皮质部的药物	(96)
双氢氯噻嗪 (96) 环戊氯噻嗪 (97)	

二、主要作用于髓样升支髓质部的药物	(97)
呋喃苯胺酸 (97) 利尿酸 (98) 汞撒利 (98)	
三、作用于远曲小管和集合管的药物	(98)
螺旋内酯 (98) 氨苯喋啶 (99)	
第 二 节 脱水药	(99)
甘露醇 (99) 山梨醇 (100)	
第 十 四 章 子宫收缩药	(101)
脑垂体后叶素 (101) 麦角制剂 (102)	
第 十 五 章 抗过敏药	(103)
一、抗组织胺药 (H_1 -受体拮抗剂)	(103)
盐酸苯海拉明 (104) 晕海宁 (104) 盐酸异丙嗪 (104) 马来酸氯苯吡胺 (104)	
盐酸氯苯丁嗪 (104)	
二、钙剂	(104)
氯化钙 (105) 葡萄糖酸钙 (105) 乳酸钙 (105)	
第 十 六 章 激素类药物	(106)
第 一 节 肾上腺皮质激素类药	(106)
一、盐皮质激素类药物	(106)
醛固酮 (106) 醋酸去氧皮质酮 (106)	
二、糖皮质激素类药物	(106)
醋酸考的松 (109) 氢化考的松 (109) 醋酸泼尼松 (109) 醋酸氢化泼尼松 (109)	
地塞米松 (109) 倍他米松 (109) 氟氢考的松 (109) 肤轻松 (109)	
第 二 节 甲状腺制剂和抗甲状腺药	(110)
一、甲状腺制剂	(110)
甲状腺片 (110) 三碘甲状腺氨酸钠 (110)	
二、硫脲类	(110)
甲基硫氧嘧啶 (111) 丙基硫氧嘧啶 (111) 他巴唑 (111) 甲亢平 (111)	
三、碘及碘化物	(111)
复方碘溶液 (112)	
第 三 节 胰岛素及其代用品	(112)
一、胰岛素	(112)
胰岛素 (112) 低精蛋白锌胰岛素 (112) 精蛋白锌胰岛素 (112)	
二、胰岛素代用品	(113)
甲磺丁脲 (113) 氯磺丙脲 (113) 优降糖 (113) 苯乙双胍 (113)	
第 四 节 性激素制剂	(114)
一、雌激素制剂	(114)
己烯雌酚 (114)	
二、孕激素制剂	(114)
黄体酮 (114)	
三、雄激素制剂	(114)

睾丸素(114)甲基睾丸素(115)丙酸睾丸素(115)

附:同化激素:苯丙酸诺龙(115)康力龙(115)

第十七章 计划生育用药 (116)

一、主要抑制排卵的避孕药 (116)

复方炔诺酮片(116)复方甲地孕酮片(116)复方甲基炔诺酮片(116)

复方己酸孕酮注射液(116)

二、抗着床避孕药 (117)

双炔失碳酯(117)

三、主要影响子宫和胎盘功能的药物 (117)

前列腺素(117)天花粉(117)

第十八章 维生素 (118)

一、水溶性维生素 (118)

维生素B₁(118)新维生素B₁(118)呋喃硫胺(118)维生素B₂(118)

维生素B₆(119)烟酸、烟酰胺(119)维生素C(119)芦丁(120)

三、脂溶性维生素 (120)

维生素A(120)维生素D(120)维生素E(121)

第十九章 抗微生物药物 (122)

第一节 磺胺类、抗菌增效剂及呋喃类药物 (122)

一、磺胺类 (122)

短、中效类:磺胺嘧啶(126)磺胺二甲嘧啶(126)磺胺甲基嘧啶(126)

磺胺异噁唑(126)磺胺甲基异噁唑(126)

长效类:磺胺甲氧嘧(126)磺胺—6—甲氧嘧啶(126)

磺胺—5—甲氧嘧啶(126)磺胺2,6二甲氧嘧啶(126)磺胺5,6二甲氧嘧啶(126)

肠道难吸收磺胺类:磺胺咪(127)酞磺胺噻唑(127)琥珀酞磺胺噻唑(127)

8—羟基喹啉酞磺胺噻唑(127)

外用磺胺类:磺胺醋酸钠(127)磺胺嘧啶银(127)甲磺灭脓(127)

二、抗菌增效剂 (127)

甲氧苄氨嘧啶(127)

三、呋喃类: (128)

呋喃妥英(128)呋喃唑酮(128)呋喃西林(128)

第二节 抗菌素 (128)

主要用于革兰氏阳性细菌感染的抗菌素 (130)

一、青霉素类: (130)

青霉素G钾或钠(132)普鲁卡因青霉素G(132)苄星青霉素G(132)

二、先锋霉素类 (132)

先锋霉素Ⅰ(133)先锋霉素Ⅱ(133)先锋霉素Ⅳ(133)

三、红霉素 (133)

主要用于革兰氏阴性细菌感染的抗菌素 (134)

一、链霉素类 (134)

硫酸链霉素(134)硫酸双氢链霉素(134)庆大霉素(135)卡那霉素(135)

新霉素 (135) 巴龙霉素 (136)	
二、多粘菌素类	(136)
多粘菌素B (136) 多粘菌素E (136) 创新霉素 (136)	
广谱抗菌素	(136)
一、氯霉素类	(137)
氯霉素 (137) 合霉素 (137)	
二、四环素类	(138)
盐酸四环素 (138) 盐酸金霉素 (139) 盐酸土霉素 (139) 强力霉素 (139)	
甲烯土霉素 (139) 二甲胺四环素 (139) 盐酸胍哌甲基四环素 (139)	
抗真菌抗菌素	(139)
灰黄霉素 (139) 克霉唑 (139) 制霉菌素 (140)	
第 三 节 抗结核病药和抗麻风病药	(143)
一、抗结核病药	(143)
异菸肼 (143) 链霉素 (143) 对氨基水杨酸钠 (144) 利福平 (144)	
乙胺丁醇 (145) 吡嗪酰胺 (145) 乙硫异菸胺 (145)	
二、抗麻风病药	(145)
氨苯砜 (145) 麻疯宁 (145)	
第 四 节 抗病毒药	(146)
金刚胺 (146) 吗啉胍 (146) 碘贰 (146)	
第 五 节 防腐消毒药	(146)
一、酚类	(147)
酚 (147) 煤酚皂溶液 (147) 鱼石脂 (147)	
二、醇类	(147)
乙醇 (147) 苯氧乙醇 (147)	
三、醛类	(147)
甲醛溶液 (147)	
四、酸和砒类	(147)
硼酸 (147) 复方硼砂溶液 (147) 水杨酸 (147) 苯甲酸 (147)	
十一烯酸 (147) 醋酸 (147) 过氧醋酸 (148) 乳酸 (148)	
五、重金属化合物	(148)
汞溴红 (148) 硫柳汞 (148) 氯化氨基汞 (148) 黄氧化汞 (148)	
硝酸银 (148) 弱蛋白银 (148) 硫酸锌 (148) 氧化锌 (148) 炉甘石 (148)	
六、卤素类	(148)
碘 (148) 漂白粉 (148) 氯胺 (148)	
七、氧化剂	(149)
高锰酸钾 (149) 过氧化氢 (149)	
八、染料类	(149)
甲紫 (149) 利瓦诺尔 (149)	
九、清洁剂	(149)
消毒净 (149) 新洁尔灭 (149) 洗必泰 (149)	

第 廿 章 抗寄生虫病药物	(150)
第 一 节 驱肠虫病药	(150)
哌嗪 (150) 四咪唑 (150) 左旋咪唑 (150) 羟萘酸苄酚宁 (151)	
噻苯哒唑 (151) 萘酸噻吩嘧啶 (151) 扑蛲灵 (152) 氯硝柳胺 (152)	
第 二 节 抗阿米巴病及抗滴虫病药	(152)
卡巴肿 (152) 喹碘仿 (153) 双碘喹啉 (153) 氯碘喹啉 (153) 安痢平 (153)	
依米丁 (153) 甲硝哒唑 (154) 甲硝氟咪唑 (154) 氯喹 (154)	
第 三 节 抗血吸虫病、丝虫病和黑热病药	(155)
一、抗血吸虫病药	(155)
酒石酸锑钾 (155) 锑—273 (156) 咪喃丙胺 (156) 硝硫氰胺 (156)	
二、抗丝虫病药	(157)
乙胺嗪 (157)	
三、抗黑热病药	(158)
葡萄糖酸锑钠 (158)	
第 四 节 抗疟药	(158)
氯喹 (158) 奎宁 (159) 伯氢喹啉 (159) 乙胺嘧啶 (160) 黄蒿素 (160)	
第 廿 一 章 抗恶性肿瘤药物	(161)
烷化剂	(162)
氮芥 (163) 氮甲 (163) 噻替哌 (163) 环磷酰胺 (163) 马利兰 (163)	
亚胺醌 (164)	
抗代谢药	(164)
甲氨喋呤 (164) 6—巯基嘌呤 (164) 氟脲嘧啶 (164) 阿糖胞苷 (165)	
抗菌素类	(165)
自力霉素 (165) 争光霉素 (165) 更生霉素 (165) 光辉霉素 (165)	
正定霉素 (166) 阿霉素 (166)	
植物药类	(166)
长春硷和醛基长春硷 (166)	
第 廿 二 章 免疫功能调节药	(167)
一、免疫抑制剂	(167)
强的松 (167) 强的松龙 (167) 环磷酰胺 (167) 硫唑嘌呤 (167)	
6—巯基嘌呤 (167) 更生霉素 (167) 氟脲素 (167)	
二、免疫增强剂	(168)
(一) 自动免疫制剂	(168)
卡介苗 (168) 百日咳菌苗 (168) 哮喘菌苗 (168)	
流行性脑脊髓膜炎菌苗 (169) 伤寒副伤寒甲、乙三联菌苗 (169) 吸附精制	
破伤风类毒素 (169) 百日咳菌苗、白喉类毒素、破伤风类毒素混合制剂 (169)	
牛痘苗 (169) 麻疹减毒活疫苗 (170) 脊髓灰白质炎糖丸活疫苗 (170) 流行性	
乙型脑炎疫苗 (170)	
(二) 被动免疫制剂	(170)
破伤风抗毒素 (170) 白喉抗毒素 (171) 丙种球蛋白 (171)	

抗狂犬病血清 (171)	
第 廿 三 章 解 毒 药	(172)
一、有机磷中毒解毒药	(172)
解磷定 (172) 双复磷 (173) 氯磷定 (173)	
二、金属和类金属中毒解毒药	(173)
二巯基丙醇 (173) 二巯基丙磺酸钠 (173) 二巯基丁二酸钠 (173)	
依地酸钙钠 (174) D-一盐酸青霉胺 (174)	
三、氰化物中毒解毒药	(174)
硫代硫酸钠 (174) 亚甲兰 (174)	
第 廿 四 章 诊 断 用 药	(175)
第 一 节 X线造影剂	(175)
一、钡盐造影剂	(175)
硫酸钡 (175)	
二、碘造影剂	(176)
泛影酸钠 (177) 泛影葡胺 (178) 碘酞酸钠 (178) 碘酞葡胺 (178)	
醋碘苯酸钠 (179) 碘吡啦哈 (179) 碘化钠 (179) 碘番酸 (180)	
甲胺碘番酸钠 (180) 碘阿芬酸 (180) 胆影酸钠 (180) 胆影葡胺 (180)	
碘化油 (181) 乙碘油 (181) 丙碘酮 (182) 碘苯酯 (182)	
三、阴性造影剂	(182)
空气 (182) 二氧化碳 (183) 氧气 (183)	
第 二 节 器官功能检查用药	(183)
酚磺酞 (183) 磺溴酞钠 (183) 靛胭脂 (183) 萤光素钠 (183)	
糖精钠 (184) 乙醚 (184) 磷酸组织胺 (184)	
附 录	(188)
一、处方学	(188)
二、药物剂型与处方及处方中常见拉丁文简写字	(189)
三、药典、毒药、剧药的概念	(191)
四、药理实验指导	(191)

第一章 总 论

第一节 绪 言

药物是人类与疾病作斗争的重要武器之一，药理学则是研究药物防治疾病道理的科学。它的研究对象主要是化学物质和生物体之间的相互作用。具体说，包括：（一）药物对机体所产生的作用（药物作用），发生这些作用的机制和规律及其临床应用；（二）药物在体内吸收、分布、转化和排泄（药代动力学）；（三）药物作用的基本规律，如作用的选择性、量效关系、构效关系、时效关系、差异性等（药效动力学）；（四）在发挥治疗作用的同时或前后，可能发生的不良反应及其防治。我们学习药理学的目的，就是要运用辩证唯物论的观点来理解和掌握药理学知识，培养分析问题和解决问题的能力，为防治疾病中合理选用药物奠定理论基础，达到充分地发挥药物的疗效，尽量减少不良反应，以便更好地为保障人民的健康做出贡献。

药理学在医学领域中是位于基础课与临床课之间起着桥梁作用的学科。它在四十年代仅在器官水平上研究药物与机体的相互作用，近卅年来，由于科学的迅速发展、先进实验方法的运用、各学科间的相互渗透，因而在分析药物作用机制方面已深入到亚细胞结构和分子水平，这就使得有可能从定性和定量两方面来阐明药物的化学结构与生物活性之间的关系，这不仅有助于提高寻找新药的效率，同时也促进了整个分子生物学的发展，如受体学说的理论就是一例。当前药理学出现了很多新的分支——如遗传药理学、免疫药理学、分子药理学、生物药理学、神经精神药理学等。这些新的领域，都展示着广阔的前景。

我国是有着几千年文明的古老国家，医药学的发展有着极其悠久的历史，古代就有神农尝百草的记载，早在公元一世纪就有《神农本草经》，收载药物达 365 种。我国最早的一部药典《唐新本草》，于公元 659 年刊行，此书比外国最早的意大利颁布的药典——Ricetario Florentino（1498 年）要早八百多年，比德国纽伦堡药典（1546 年）要早几百年。明代我国伟大的医药学家李时珍历经廿八年的艰苦奋斗，写成了举世闻名的巨著《本草纲目》，收载药物达 1892 种，对研究药物的形态、功能有着卓越的贡献，是我国医药学宝库中珍贵的资料，已译成英、日、法、德等六种文字出版，流传于世界。

新中国成立后，在防治肿瘤、心血管疾病、慢性支气管炎、寄生虫病药和避孕药等的药理学研究方面均取得了显著成绩。在今后四个现代化的过程中，我国药理学必须在现代药理学新的发展趋势下，根据我国医药学的优点和特点，坚持走中西医结合的道路，为攀登医学科学高峰而奋勇迈进。

第二节 药物的作用

一、药物的基本作用

药物的作用，主要是指机体在药物的影响下所产生的机能活动的改变。药物调节机

体机能，基本上表现为两种形式：一种是机能活动增强，即由弱活动变为强活动，这种变化称为兴奋；另一种是机能活动减弱，即由强活动变为弱活动，这种变化称为抑制。兴奋和抑制是矛盾的两个方面，相互对立，在一定条件下可以转化。兴奋后有出现后抑制现象。抑制解除后也有回跃现象。过度的兴奋往往会引起惊厥，长时间的惊厥，会转化为衰竭，过度的抑制使机能活动降低到接近停止状态称为麻痹。

药物对机体的作用还表现在机体物质代谢的加速或抑制，如肾上腺素可使血糖升高，胰岛素可使血糖下降。如抗菌药物通过干扰病原体酶的代谢，抑制其生长。此外，有些药物的作用表现在组织形态的改变，如铁盐或维生素B₁₂，可促进红细胞的再生等。所以药物的基本作用可以概括的认为：当药物以一定的浓度到达作用部位时，就会与机体细胞某种成分相互作用改变着细胞的机能，从而引起生理学上的变化可以是兴奋或抑制，生化学上的变化可以是某些酶活动的加强或减弱。

二、药物作用的类型

为便于了解和分析药物的作用，可以从不同的角度，将药物作用分为各种类型。

选择作用和普遍作用：药物对机体某些组织或细胞呈现最明显的作用，而不是对机体所有组织或器官发生同等强度的作用，此称为选择作用，亦称为特异性（例如麦角对子宫的作用）；与此相反，有些药物对各种组织都有类似的影响，此称为普遍作用（因这些药物都能损害组织细胞，故又称原生质毒）。药物的选择性是由于药物与某种组织细胞有亲和力，当然也与组织细胞对药物的反应性及药物在体内的分布有关。必须指出，药物直接的选择作用是基本作用，这是药物的个性。它表明，任何药物都是有其特定的适应症，临床用药时，必须掌握药物的特定作用及其适应症。这也是防治疾病选用药物的根据。

局部作用和吸收作用：在药物未吸收入血之前出现的作用称为局部作用（例如普鲁卡因的局部麻醉作用）；药物吸收到血液循环以后所出现的作用称为吸收作用（例如普鲁卡因大量吸收后对中枢的兴奋作用）。当治疗上需要药物的局部作用时，应设法使药物停留在用药的局部，如在普鲁卡因溶液中加入少量的肾上腺素以延缓吸收，从而使局麻时间延长。

直接作用和间接作用：药物和组织接触所产生的作用称为直接作用（例如洋地黄增强心肌收缩力，使心脏输出量增加）；由此继而产生的作用称为间接作用（例如洋地黄在使心脏输出量增加、循环改善后而产生利尿、水肿消退等）。

预防作用：能达到预防发病效果的称预防作用（例如口服乙氨嘧啶可预防疟疾）。

治疗作用：能达到治疗效果的作用称治疗作用（例如双氢克尿塞的利尿作用）。治疗作用可分为“对症治疗”及“对因治疗”：对症治疗或称治标，主要在于减轻或解除疾病的症状（例如解热镇痛药的退热）。对症治疗虽然不能消除病因，但是在有些病情危急的时候，如休克、惊厥、心力衰竭、酸中毒等情况下，采取有效的对症治疗是当务之急。对因治疗或称治本。针对病因进行治疗，起到消除病因的作用（例如应用抗菌药物以消灭细菌感染）。

不良反应 可以分为：

副作用：药物在治疗剂量下出现与治疗目的无关的作用，如磺胺药引起的恶心、呕吐、眩晕等。但有些药物的副作用是随治疗目的而改变的，如阿托品用于解痉时，其抑

制腺体分泌就是副作用。而在麻醉前给药时,则抑制腺体分泌就成为治疗作用,而其他作用则成为副作用。

毒性反应: 由于药物剂量过大,用药时间过长或者机体的代谢、排泄功能因病发生障碍,药物在体内蓄积,而出现不利于机体的反应。例如洋地黄类强心甙过量可出现很多毒性反应。

过敏反应: 又称变态反应,是由于病人的体质特异,对药物产生的病理性免疫反应。一般与剂量无关。如对青霉素过敏者,即可出现药热、药疹、哮喘以至过敏性休克。

后遗症反应: 停药后继续存在或新出现的不良反应。如应用广谱抗菌素后,因其抑制了肠道正常菌群,导致继发性感染和某些维生素缺乏症。由于药物诱发的药源性(或称医源性)疾病,是药物治疗后引起的较难恢复的后遗作用。有些药物如丙咪嗪、环磷酰胺等对胎儿有致畸作用。

三、药物作用的机制

药物到底怎样与机体发生作用?为什么许多药物在适当的剂量下就能发生作用,而且还有相对的特异性,这是药理学中一个根本的理论性问题,这些问题的阐明,有助于解决防治疾病中用药的基本理论。

机体的机能活动反映着一系列物理化学反应的进行——即新陈代谢过程。机体的新陈代谢过程依靠许多酶系统进行。药物进入体内必然要影响机体的某一方面酶系统的活动,使之增强(胰岛素促进已糖激酶的活性);或使之抑制(如新斯的明抑制胆碱酯酶),从而引起一系列的药理反应。

随着科学的进展,生物学已深入到亚细胞结构。这样也相应的从分子水平来分析药物作用的机制。其中受体学说已成为药理理论的基础。现在许多学科都利用了这个概念。众所周知,临床应用的很多药物,如去甲肾上腺素、脑垂体后叶素、组织胺等用量很小,但机体的反应却非常强烈。据计算这样小量的药物是不足以形成一个单分子层覆盖整个细胞的表面,因而推论固定于细胞而发生效应的药物,仅占细胞表面极小部分,进而说明药物作用,是通过药物与细胞的一些特殊受体(受点)结合而发生的。

受体的本质究竟是什么?药物又是怎样与受体结合的,对它的认识正在不断深化。多数认为受体是直接与药物作用的细胞成分,是构成细胞的大分子(可能是蛋白质、脂蛋白、核酸等),可能是细胞膜的一部分,酶或酶的一部分。受体的类型很多,如肾上腺素能及胆碱能受体、多巴胺受体、5-羟色胺受体、组织胺受体、激素受体、吗啡受体等。中枢及外周效应器官都存在着相应的受体,既存在于细胞膜表面,也存在于细胞内。不同的受体可以接受不同化学构造的物质,进而发生生化作用,这就是药物作用的受体学说。

此外,也有些药物在产生作用时并不是与细胞的特殊受体结合,而是影响细胞膜的功能,改变其通透性。如苯妥英钠是由于稳定细胞膜,影响钠离子转运和电位传导,而发生抗癫痫作用。还有些药物由于改变体内活性物质的摄取和释放而发挥药理作用,如利血平由于使肾上腺素能神经末梢递质的贮存量排空和重摄取障碍而产生降低血压。总之,药物产生作用的机制是多方面的。

第三节 药物的体内过程

机体将药物吸收入血液,通过血液循环将药物分布到身体各部位,使药物发生化学

变化或原形排出体外。这个过程称体内过程（又称药代动力学）。

一、吸收 药物口服后，除极少数药物如乙醇、水杨酸盐等可在胃内吸收外，一般均经胃进入小肠，在肠液与胰液硷性的影响下，几乎所有不溶于水或不溶于胃酸的物质均被溶解。要吸收必须通过胃肠粘膜和毛细血管壁的细胞膜等。通过细胞膜的方式有二种：一种是被动转运过程，脂溶性物质可直接通过细胞膜类脂质层；小分子水溶性药物一般可透过细胞膜的嗜水微小缝隙。通过细胞膜的药物从高浓度的一方扩散到低浓度的一方，这无需细胞本身消耗能量，称为被动转运过程。另一种称为主动转运过程，这种形式需要酶的参加和消耗能量，可将药物从低浓度一方转运到高浓度一方。大多数被吸收的物质由肠道吸收后通过门静脉系统，进入肝脏，然后由下腔静脉达到大循环而分布于全身。药物进入机体的速度和在血液或组织中的浓度均与下列因素有关：

（一）**给药途径**：药物吸收到血液的速度，其次序是：静脉注射＞吸入给药＞肌肉注射＞皮下注射＞直肠或舌下给药＞口服给药＞皮肤给药。

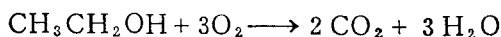
（二）**药物的物理性状**：水溶液易吸收，油溶液次之，胶状液或混悬液难吸收。

（三）**吸收环境**：吸收面积大，血管丰富，药物在吸收面停留时间长，或组织发炎时，则吸收增多。吸收环境的PH和胃肠内容物的多少，均影响药物的吸收。胃内有脂肪食物时，常使药物吸收减慢。

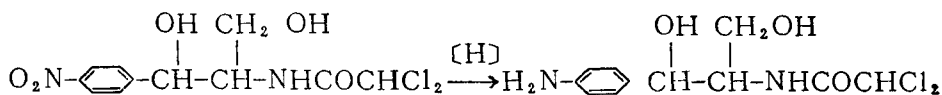
二、分布 吸收后的药物，在体内的分布颇不一致。例如钙、镁、磷沉着于骨内，溴离子、碘离子多分布于细胞外液中，氯喹等则多分布于细胞内，磺胺药则分布于全身体液中。有些药物如磺胺类能与血浆蛋白呈可逆性结合，而影响药物在组织中的分布。体内的某些屏障可影响药物的分布，如血脑屏障（因中枢神经系统的毛细血管被神经胶质细胞所包围）阻止水溶性化合物的通透性，但脂溶性物质较易通透。当这种屏障发炎时，通透性可发生改变。

三、代谢 药物的代谢又称药物的生物转化。经代谢变化后，药物的作用和毒性减低或消失的，称为“失活”或“解毒”。经变化方能发挥其药理作用的，称为“活化”。药物代谢最重要的方式，大体可归纳为以下几种：

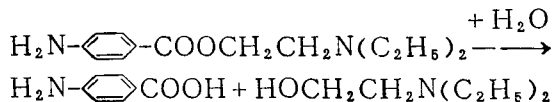
氧化：如乙醇被氧化成水和二氧化碳。



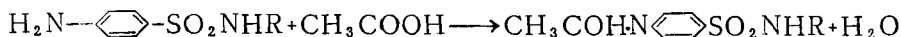
还原：如氯霉素的硝基还原为氨基。



分解：如普鲁卡因水解为对位氨基苯甲酸和二乙氨基乙醇。



结合：如磺胺类药物与醋酸结合为乙酰磺胺类



此外，在药物生物转化中微粒体酶起着重要作用。肝微粒体药物代谢酶是一个混合功能氧化酶系统。能使许多脂溶性药物和外来化合物变为更易溶于水的代谢物。微粒体羟化酶可被某些药物所诱导（兴奋）或抑制。如苯巴比妥等可使平滑内质网增生，从而增加微粒体羟化酶的含量。早产儿和肝脏功能不全者可发生微粒体酶的不足。另外某些药

物可以抑制药物代谢酶。

四、排泄 体内药物的排出，主要是经过肾脏，其次是经呼吸道、肠道、乳汁、汗腺、唾液腺排出。少数药物如洋地黄、阿斯匹林、酒石酸锑钾等可随胆汁排出至十二指肠，但部分又可被再吸收，减少了药物的排出量，易引起蓄积性中毒。药物的排泄速度影响药物作用时间的长短和后遗作用的有无。

代谢和排泄是机体清除药物的二种方式。药物与毒物在体内停留和蓄积的程度，随肾、肝脏的机能状态而有不同。肝、肾机能不良时，药物消除受到影响，易致中毒，用药时应予特别注意。

一般用生物半衰期（ $t_{1/2}$ = 血液中药物浓度降低一半时所需的时间）作为药物清除率的标志，然后根据生物半衰期的长短，决定单位时间内给药次数和剂量。

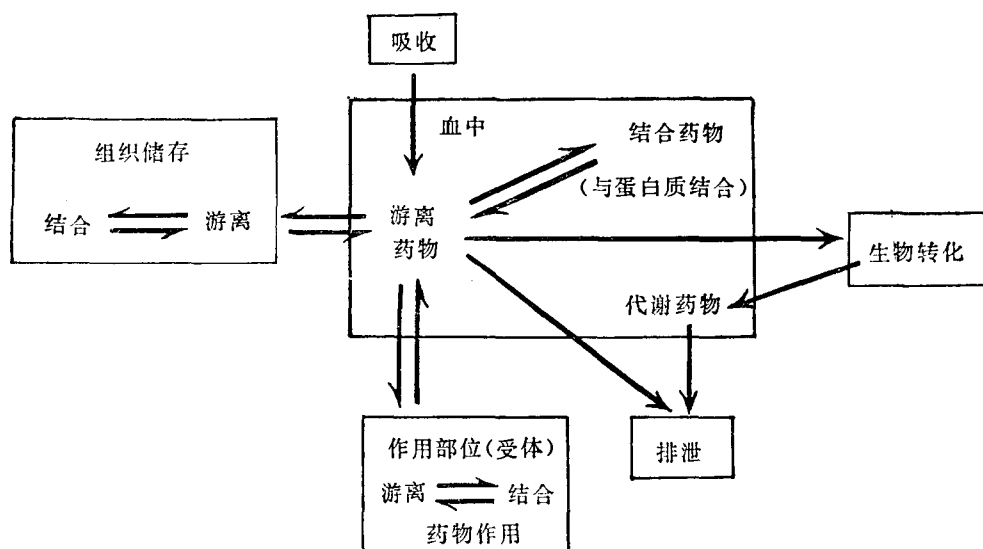


图 1—1 药物的体内过程示意图

第四节 影响药物作用的因素

一、药物方面的因素

（一）物理因素

1. **溶解度**：药物的溶解度和药物的吸收、转运、作用均有密切关系。如硫酸钡不溶于水，口服不吸收，停留在消化道内，故可作X线造影剂。氯化钡因可溶于水，易吸收，故引起中毒。近年来研究认为同一药物剂型不同，血浆浓度可以不同，也就是它们吸收的快慢和多少有所不同，这叫生物可利用度。如地高辛片和溶液口服比较，前者吸收量较后者低，因此血液浓度差异也很大。

2. **浓度**：药物的浓度不同其渗透压不同，其作用亦有差异，如50%的高渗葡萄糖溶液，造成血管内暂时性渗透压增高，可作为脱水剂，但5%的等渗葡萄糖溶液即无此作用。

（二）化学结构

药物作用的特异性取决于化学反应的专一性，而后者又取决于药物的化学结构，因