

用药的科学

李德华 何绍雄 编著



健康知识丛书

用 药 的 科 学

李德华 何绍雄 编著

天津科学技术出版社

责任编辑：李馥华 雷彭年

用 药 的 科 学

李德华 何绍雄 编著

天津科学技术出版社出版

天津市赤峰道124号

天津新华印刷四厂印刷

新华书店天津发行所发行

开本 787×1092毫米 1/32 印张 5 插页 1 字数 102,000

一九八六年一月第一版

一九八六年一月第一次印刷

印数：1—17·100

书号：14212·147 定价：0.80 元

前　　言

当今科学技术的发展日新月异，人们对药物作用的认识已深入到分子水平，从而对药物作用的实质、毒副反应的潜在和远期危害有了更清楚的认识。随着药物科学的发展，又不断发现了许多药物应用上的大量新问题，这些问题一方面关系到如何才能提高药物治疗效果，另方面又涉及过去未曾发现过的许多毒副反应，尤其是随着各种新药的大量涌现所带来的许多新问题。这些都密切关联着广大人民的身体健康和下一代人的生长、发育以及老年人的延年益寿等问题，因此如何科学地使用药物的问题，就显得特别重要了，以家庭常用的阿斯匹林为例，过去一直认为是安全的药物，今天已发现它的种种严重不良反应。还有些药物不仅对服用药物的病人有危害，而且还可影响到他们下一代的健康，象一些畸型胎儿的娩出，其中有的就是由药物所引起的。1982年9月，卫生部颁发了淘汰127种药品的通知，就是针对那些效果差和具有严重毒副反应的药品所采取的一项重要措施。因此，对于药物使用上的各种问题的解决，离开学习和掌握有关用药的科学知识也是不可能的。从本书搜集的资料中可知，因不能合理用药而发生的种种药疗事故，在医疗单位中是屡见不鲜的，更不用说一般的群众了。鉴于这种情况，本书尽力用通俗的语言去介绍当代关于合理用药方面的各种必要知识，特别是关于那些最新发展的有关临床药理学和临床药学

等方面的知识、用药物科学的最新知识来回答药物使用上的种种问题。所以，本书对医药卫生人员、医、药院校师生、科技工作者、中、小学教师、青年学生以及广大群众均有一定参考意义。

作者

一九八四年

目 录

第一章	什么是药物.....	(1)
第二章	药物在人体内怎样起作用的.....	(6)
第三章	药物在人体里起什么变化.....	(10)
第四章	怎样才能做到对症下药.....	(20)
第五章	为什么药物用量要个体化.....	(23)
第六章	西药的“因人施治”	(28)
第七章	药品质量的新问题：生物利用度.....	(38)
第八章	谈谈给药方法.....	(43)
第九章	用药时间要讲究.....	(49)
第十章	合并用药的学问.....	(57)
第十一章	药物能提高人体的抵抗力吗.....	(64)
第十二章	药物能使人长寿吗.....	(71)
第十三章	中草药的功效.....	(75)
第十四章	有趣的生化药.....	(78)
第十五章	怎样选用抗癌药.....	(84)
第十六章	孕乳妇用药须知.....	(104)
第十七章	有些药物为什么引起畸胎或致癌.....	(109)
第十八章	药物中毒怎么办.....	(117)
第十九章	药物与营养.....	(130)
第二十章	嗜酒与服药.....	(138)
第二十一章	漫谈不吃药就不好受.....	(143)
第二十二章	药品的保存.....	(147)

第一章 什么是药物

药物这个名词，由来已久，对任何人都不陌生。但是，这并不意味着人们对药物就有了全面正确的认识。据了解，国内应用的药物达四千余种，国外已逾万种。在药物种类如此众多，数量惊人并广泛应用的今天，对药物有一个正确的认识对不论何人的卫生与健康均有重要意义。

从近五十年药物发展的历史来看，人们对药物的认识在发生不断的变化。例如，自1935年磺胺药问世以来，由于对传染性疾病的优异疗效，激发了人们研究发现新药的巨大热情，到了1940年青霉素登上历史舞台之后的一个时期，药物发展进入了抗菌素新时代，药物向高效、特效的目标前进，各种新药纷纷登场，如雨后春笋，可以说是药物发展的黄金时代。这一时期药物的特效作用给人们以深刻的印象，使人们对药物的神奇作用带上幻想的色彩，而把药物看作是万能的。

可是进入60年代之后不久，发生了西德反应停事件，（反应停是一种镇静药，曾用于妇女的妊娠反应，有一定效果）在西欧产生了数千例畸胎儿的大悲剧，震动了世界，随之引起了世界各国对药物研究和监督的重视，此时人们如从梦中惊醒，认识到药物并非万能，而且具有多种毒副作用，特别是存在着一时不易被察觉的潜在性危险，开始真正引起人们的严重注意。目前提出新药要进行致癌、致畸、致突变的所谓三致研究，正是针对药物可能发生潜在性危害而进行

的。60年代中后期到70年代，由于世界各国专家对药物的毒副作用进行了多种研究和观察，人们对药物的认识进一步发生变化，尤其是关于药物和其他化学物质的致癌研究，受到了国际上的广泛重视，从中也发现了不少有致癌作用的药物。后来又不断发现由药物引起的各种疾病，随着一些有关药源性疾病的专著相继问世，至此问题就更加明显，药物具有两重性，疗效与毒性均不应忽视。

到了80年代的今天，关于药物的两重性，尤其是关于药物的毒副作用在非药学专业人员的广大人群中，并未引起重视，原因还是对这个重要问题缺乏认识。药物万能或药物无害的观念还相当深地存留人们的头脑之中，这就是为什么今天滥用药物的问题所在。尤其不了解药物仅起辅助作用，而且是防治疾病的方法之一，如失眠的人，主要应从调整生活节律，去除引起失眠的原因入手，而不应单纯长期依赖催眠药物，而且催眠药长期应用可以形成习惯性，药物使用时间越长，越容易发生毒副作用。以上问题的根源还是在于对药物缺乏正确的认识，现在让我们来了解一下什么叫药物的科学含义吧！

一种或几种化学物质在一起用来诊断、预防和治疗疾病或缓解疾病症状，或可以改变人体生理功能的物质，均可称之为药物。

从以上定义来看，今天所谓药物包括的范围相当广泛，不仅包括治病、预防和诊断疾病（诊断用药），还包括可以改变人体生理功能的物质，说明今日之药物远远超出了以往药物只是治病的范围。具体地讲，各种化学物质可改变人体生理功能的如食品添加剂、经济作物杀虫剂、化肥以及空

气，水和食品的污染物等均在此列。这一点从表面上看，似乎不好理解，但从实质上看，则反映了事物的内部规律。这里最关键之处，是药物与毒物是一身二任，药物依所用剂量之不同，既是药物也是毒物，关于这一认识，从中国古代中药起源的论述中，与所谓“神农尝百草，一日而遇七十毒”的说法也是一致的，历史上许多药物来自毒物。这一个认识非常重要，它可指导我们在应用药物时注意发挥药物的治病作用而极力避免和防止其不良反应的一面。但是现实的情况并非如此，不仅社会上滥用药物的情况还相当严重，而且就是在医疗单位中药物的应用也存在不少问题。据有关报道，药疗事故占医疗事故的30%，药源性疾病约占常见病的8%，不难看出这一个问题的严重性。当然真正解决这些问题，不单是提高对药物的认识问题，不过也却是解决这一问题的一个前提条件。

还有一个营养药的问题，也存在着滥用的情况，有不少人把营养药看作有益于健康之宝，或看作是有益无损，其实不然。如有人用维生素E做为防老药物，认为无不良作用，可是已有不少关于它引起严重毒副反应的报道。维生素A用量过大可以引起副作用，已为许多人所了解。所以，用药物来纠正某些疾病引起的某些营养物缺乏是可取的，但是用营养药来补身体之“虚弱”，或当作一般的“补品”则是不可取的。自古中医的所谓药补不如食补就是这个道理。

由以上叙述，不仅不可滥用药物，而且掌握正确的用药剂量也是非常重要的。尤其是对那些治疗量与中毒量接近的药物，应用时更应慎重。关于药物剂量的意义见图1。由图可知严格按照规定剂量用药的重要性，如果用量过大超出极

量即可中毒。

今日认为比较理想的药应是高效、低毒或无毒，但实际上无毒的药是很少的，如上面提到的即使是营养性药物也并非完全无毒。当前所用的药物中，疗效不高且毒副作用大的药物并不少见，这是因为对某些疾病来说，尚无较好的药物可以代替。以1982年9月卫生部公布的淘汰127种药品的通知（见附录1）为例，如卡那霉素虽对耳蜗神经表现较大的毒性，使用剂量过大或时间过长有引起永久性耳聋的危险，但因其对急性感染确实有效，况且尚无较好的同类品种可以代替，故仍然保留使用。

由于今日许多药物存在着各种缺点和问题，另外还有一些难治之症缺乏有效药物，故人们寄希望于新药的发现。一般来说新药应当比老药具有某些优点，但并不等于新药就不存在缺点和问题，尤其是因为新药使用的历史短，临床经验不够多，有些尚未被发现的毒副反应在继续应用中可能会发生，应当引起注意。总之，不管老药与新药，均应有针对性地、有选择地加以适当应用，不应盲目使用或滥用药物。当今滥用抗菌素的情况就很严重，例如对于一般感冒有人也用抗菌素，其结果不仅对疾病无益还可发生毒副反应，尤其是抗菌素的滥用使抗药的细菌不断增多，当疾病确需抗菌素时，药物不再有效，以致因不能控制而造成某些传染病的流行，其后果是不堪设想的。

这里关于中药也提几句，一般认为中药作用缓和，较西药安全，这固然有其正确的一面，中药大部是植物来源或其他天然产物，多数药性温和，但中药中也有不少剧毒药品，过去因应用不当或剂量过大引起中毒甚至死亡的例子也屡有

报道。因此对服用中药也不应随意进行，因为药物在本质上是一致的，同样具有不良反应的一面。

以上所说，关于正确认识药物的作用至关重要，当今社会上滥用药物、药疗事故以至药源性疾病的发生都与对药物缺乏正确的认识有关，尤其是药物万能的错误观念所造成的不良后果是贻害无穷的。所以应当慎用药物。当然针对疾病的需要即时用药，早期治疗也是重要的，但必须在医师、药师的帮助指导下正确使用药物，才能取得好的效果。

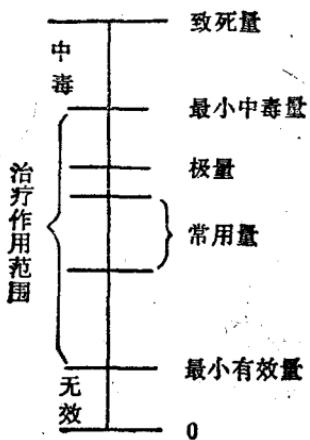


图1 药物疗效与中毒的用量界限

第二章 药物在人体内 怎样起作用的

药物既然对疾病有效，而且有些药物还是特效，那么很自然人们要问药物是怎样发生疗效的呢？显然，这个问题不仅对医师、药师及药理学工作者深入认识药物作用的本质和规律从而指导用药十分重要，就是对一般人来说，了解一些药物作用原理，对加深关于药物的性质和作用的理解上，也将有所帮助。

当前是分子药理学时代，机体的器官、组织和细胞最终还是由分子构成的，药物分子与机体分子的相互作用就构成了药物作用的分子基础，所以一切药物的作用，最终均可在分子构成或所发生的分子改变上找到原因。生物机体的一切功能变化，均可归结为生物物理与生物化学的变化，因此药物的作用也就是干扰或参与机体的这些变化。但由于药物的分子结构各不相同，其作用原理也是多种多样的。现分别加以论述如下：

一、药物引起一般理化条件的改变 最简单的例子如凡士林对皮肤的润滑和保护作用，它纯粹是一种物理性能；活性炭用于解毒和腹泻，是由于其有很强的吸附性能，将毒物或毒素加以吸附之后排出体外；苦味健胃药如复方龙胆酊，是通过作用于舌部的味觉感受器，提高了食物中枢的兴奋

性，使消化液分泌增加，从而增进了食欲；还有，如乙醚、氯仿等全身麻醉药，它们的化学结构虽不相似，但是却有着共同的物理性质，都易溶于类脂质，而不易溶于水，有相当高的脂/水分配系数，它们的麻醉作用是由于其积累于富含脂质的神经组织，使神经细胞膜的通透性发生改变，从而引起神经冲动的传导障碍，导致麻醉作用的发生。其他如抗酸药通过简单的化学中和作用，使胃酸的酸度降低。

二、药物干扰或参与机体的分子生物学过程 这一类药物的作用随分子结构的改变而发生特异性的变化，药物在发生作用之前先与机体的某些特定的生物分子相结合，而后发生反应。不同的药物与不同的机体分子发生反应，然后引起一系列生理功能的变化，这些机体细胞中的分子被称之为受体，不同的药物与不同的受体相结合，发生不同的生理效应，这就是药物作用的受体学说。该学说早在本世纪初就被提出，并用锁与钥匙形象地比喻受体与药物的关系，不同的药物与不同的受体结合，正象是一把钥匙开一把锁，是一种高度特异性的关系。

这里对受体的概念再提供一些说明。例如结构特异性药物，应用很小的药量即可起作用，这些药物不可能在体内细胞表面形成完全覆盖的单分子层，而是与位于机体细胞中特定分子的专一性受体形成复合物的结果。数学计算表明，一克分子的药物含有 6.02×10^{23} 个分子，如果该药的分子量是200，则1毫克（有效量）将含有 3×10^{18} 个分子，人体大约由 3×10^{13} 个细胞组成，因此每个细胞将受到 1×10^5 个药物分子的作用。一个红细胞大约含有 1×10^{10} 个分子，假定每个细胞都含有相等数量的分子，则可推测每一个药物分子将

分配到 1×10^5 个人体分子。由此可知药物仅能覆盖一小部分人体分子。药理学家CLARK曾计算过：结合于蟾蜍离体心室细胞的哇巴因（强心药）只能覆盖2.5%的细胞表面；而降低蟾蜍心率50%的乙酰胆碱剂量，其所覆盖的面积，只相当于心室细胞表面的0.016%。

上述这些简单的计算表明，结构特异性药物并非作用于身体所有分子，而仅仅作用于一些特定的分子，这就是构成所谓受体的那些分子。这个关于受体的概念，已被现代分子药理学的研究所证明，而且还对它进行了化学的分离、提纯和鉴定。到目前为止虽然并非对多种受体均已弄清，但是关于受体是蛋白质或可能就是酶，已经得到了证明。例如，去甲肾上腺素作用于细胞膜上的腺苷酸环化酶，以促进三磷酸腺苷转变成环磷酸腺苷，从而引起心脏兴奋等肾上腺素乙型受体生理效应（见图2）。

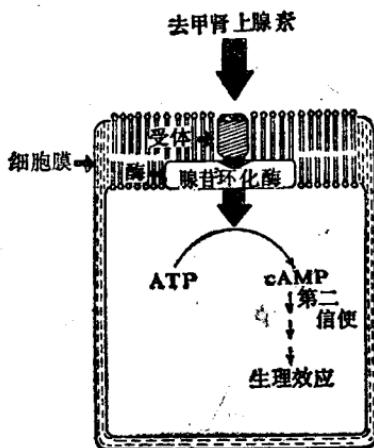


图2 去甲肾上腺素作用于膜受体产生生理效应的模式图

总之，当前分子药理学的发展，药物对核酸、蛋白质及酶影响的深入研究，使人们对药物作用原理的认识已达到一个新的高度，这不仅对药物如何能治病加深了理解，而且为新药的发现，以至对生命活动奥秘的了解，均开辟了更为广阔前景。

第三章 药物在人体里起什么变化

一、药物在体内发生的变化 大家都知道，吃药是为了治病，因此对药物在体内发生什么作用，有什么疗效，有什么毒副作用都十分关心。对于药物进入体内后，身体对外来的药物要进行什么样的反应，大家就注意不多了。其实机体对进入体内的药物要进行一系列的反应，这种反应变化对药物疗效和毒性关系很大。那么，药物进入人体后，发生什么样的变化呢？通常，药物进入体内，首先要从用药部位（如口服给药时在胃肠道）吸收入血液循环，再分布至全身各部分，从而发生在体内各器官间位置的变化，这种变化称为药物在体内的转运。另外，许多药物在体内还要发生化学结构的变化，此称为结构转化。药物在体内的结构转化和位置的变化合起来称之为药物的代谢过程或体内过程，或药物代谢。下面让我们来介绍一下药物代谢的过程。

1. 药物在体内的转运。药物的体内转运过程包括吸收、分布和排泄。所谓吸收就是药物从用药部位进入循环系统的过程，除静脉注射直接进入血液循环而没有吸收过程外，其他各种给药方式（如口服、肌肉或皮下注射等，参见本书《谈谈给药方法》章）都需由给药部位吸收入血。药物只有吸收进入血液循环之后，才能到达有病的部位发生治疗作用。所以，除了少数药物如驱肠虫药，碳片等服用后可不经吸收而发挥治疗作用外，绝大多数药物的吸收过程是治疗作

用开始的第一步。现在已经证明，药物的疗效与药物的血浓度密切相关，尽管各种动物对某一药物的治疗剂量都不相同，但其有效血浓度范围却基本相似。如保泰松的抗炎剂量，兔为5~10毫克/公斤，人类为300毫克/公斤，但有效血浓度范围都是100~150毫克/升。临床已证明许多药物的血浓度与其疗效和毒性密切相关，如水杨酸，其血浓度为250~300微克/毫升时具抗风湿作用，大于550微克/毫升就出现毒性反应。所以药物如果不能良好吸收，就难以奏效。要使药物吸收良好，药物本身的理化性质很有关系，一般来说脂溶性越大，解离度越小，颗粒越小的越容易被吸收；所以一种药物做成不同剂型时，由于上述性质的不同，吸收常是不同的。另外，机体本身的因素对吸收也很有影响，如酸性药物在胃中的解离度小易被吸收，碱性药物则难以吸收，如果使胃液变碱，则碱性药物吸收增加。

药物吸收入血后随血液循环分布到全身各组织中，此即药物的分布过程，药物的血浓度与组织浓度通常保持一定的比例关系，进入组织的药物即可在作用部位发挥治疗作用。因之，药物在组织中含量的高低及持续时间的长短，将直接决定药物作用的强弱及时间的长短；而这些又是决定临床用药的剂量大小和给药间隔时间等所必须考虑的问题。药物的溶解度、通过细胞膜的能力以及与血液和组织里的蛋白质的结合率等均能影响药物的分布。所以不同药物在组织中的分布是不同的。如洋地黄毒甙在心脏里含量高，脂溶性药物在脂肪中浓度较高，脂溶性较高的药物常在脑组织中含量较高，如硫喷妥是一种脂溶性较高的药物，给药1~2分钟后便可在中枢神经系统有很高的浓度。药物与血浆蛋白的结合