

全国普通医药中专教材
全国普通医药中专教材建设委员会 组织编写

药理学

Yao Li Xue

主编 竺芝芬 主审 苏怀德

中国医药科技出版社

全国普通医药中专教材

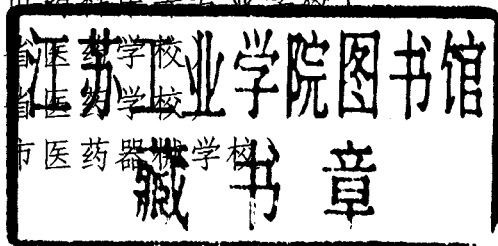
药 理 学

全国普通医药中专教材建设委员会 组织编写

主 编 竺芝芬 (浙江省医药学校)
主 审 苏怀德 (国家药品监督管理局)

参编人员 (按姓氏笔画排序)

齐赤虹 (河南省医药学校)
李振新 (山东省医药学校)
陆 艺 (天津市药科中等专业学校)
俞松林 (浙江省医药学校)
韩 茹 (安徽省医药学校)
潘 雪 (北京市医药器械学校)



中国医药科技出版社

内 容 提 要

本书是全国普通医药中专教材建设委员会组织编写的全国普通医药中专教材之一。全书语言流畅,内容安排合理、新颖,包括总论,中枢神经系统药物,外周神经系统药物,内脏系统药物,激素类药物,抗病原微生物药物,抗寄生虫病药物,抗病毒、抗肿瘤及免疫药物,新药药理研究基础知识,每章后都有思考题。本书有12个实验且附讨论题。

本书为普通医药中专的教学用书,还适用于医药技工学校和医药职工中专的教学,同时,还可作为医院和药厂等相关单位从事药事工作人员培训的参考书。

图书在版编目(CIP)数据

药理学/竺芝芬主编. —北京:中国医药科技出版社, 2000.1

全国普通医药中专教材

ISBN 7-5067-2143-0

I. 药... II. 竺... III. 药理学-专业学校-教材 IV. R96

中国版本图书馆CIP数据核字(1999)第56790号

出版 中国医药科技出版社
地址 北京市海淀区文慧园北路甲22号
邮编 100088
电话 010-62244206
网址 www.mpsky.com.cn
规格 787×1092mm 1/16
印张 14³/₄
字数 319千字
印数 73001—80000
版次 2000年1月第1版
印次 2006年1月第12次印刷
印刷 三河富华印刷包装有限公司
经销 全国各地新华书店
书号 ISBN 7-5067-2143-0/G·0209
定价 22.00元

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

全国普通医药中专教材建设委员会名单

- 主任委员** 苏怀德(中国医药教育协会常务副会长、
国家药品监督管理局)
- 常务副主任委员** 王书林 (四川省医药学校)
- 副主任委员** 林锦兴 (山东省医药工业学校)
- 贾景华 (辽宁省医疗器械学校)
- 周晓明 (山西省中药材学校)
- 顾问** 齐宗韶 (广州市医药中等专业学校)
- 路振山 (天津市药科中等专业学校)
- 竺芝芬 (浙江省医药学校)
- 委员** 左淑芬 (河南省医药学校)
- 缪立德 (湖北省制药工业学校)
- 夏海云 (湖南省医药学校)
- 谢淑俊 (北京市医药器械学校)
- 贾江峰 (江西省医药学校)
- 唐介眉 (江苏省医药学校)
- 周琦 (安徽省医药学校)
- 周慧君 (上海市医药学校)
- 徐文强 (江苏省药科学校)
- 沃联群 (浙江省医药学校)
- 梁向东 (广州市医药中等专业学校)
- 汤浚溪 (天津市药科中等专业学校)
- 杨群华 (广东省医药学校)
- 缪存信 (福建医药学校)
- 秘书** 刘佳 (四川省医药学校)

前 言

我国普通医药中等专业教育兴起于 20 世纪 50 年代。以后历经曲折,有一定进步。80 年代以来,在改革开放国策的指引下始获得巨大发展。历年来所培养的大量人才在推动全国医药事业的持续发展中起到了重要作用。

但是,几十年来医药中专教育一直缺少自己的规范化教材,长期存在着靠借用其他专业或其他层次教材应付教学急需的尴尬被动局面。原国家医药管理局科技教育司履行“指导全国药学教育”和“为基层服务”的职责,应各省普通医药中专学校的要求,于 80 年代后期开始组织各校共同编写教材,以解决各校之急需。经过几年实践,有关普通医药中专教材建设的规章制度日趋完善,遂于 1998 年正式成立全国普通医药中专教材建设委员会。该委员会隶属于中国医药教育协会的二级组织——职业技术教育委员会。本系列教材编写的基本依据是原国家医药管理局科技教育司颁布的全日制普通医药中等专业学校“指导性教学大纲汇编”(医药类各专业,1997 年 7 月),同时根据中等职业教育的改革发展和各地区的办学条件及对人才需求的差别,体现了一定的灵活性。

全国普通医药中专教材建设委员会的指导思想是:认真贯彻党的教育方针和职业教育法,面向 21 世纪,根据中等职业教育教学改革精神,搞好医药中专教材建设工作。教材建设的基本过程是:各校根据教学需要提出急需编写的教材建议;委员会从各校建议中确定分阶段编写的教材品种;各校根据委员会制订的对主编和参编人员的要求,申报主参编人员;经教材建设委员会审定,择优组成各门教材编写队伍。编写过程实行主编负责制,同时每门教材特聘主审一人,其主要职责是审定教材业务内容以保证质量。各校对教材工作均高度重视,纷纷派出优秀教师参加编写,中国医药科技出版社也给予了大力支持,才使得本系列教材建设能在较短时间内完成。

经各校的共同努力,第一阶段编写的 12 门教材、第二阶段编写的 14 门教材进展顺利,均将按计划供应教学使用。今后还将按实际需要组织第三阶段教材建设和若干教学参考书的编写,使新编写的中等教材形成较为完整的系列。这些工作在医药中等教育发展历史上具有首创意义,它对规范教材规格、确保教学质量、提高师资水平以及促进校际交流和团结都将会发挥重要作用。但本系列教材建设缺乏经验,时间又紧,因此某些部分略显粗糙是很难避免的,其质量如何也有待教学实践检验。教材建设委员会将组织制订教材质量评估体系,逐步开展教材评估和评优工作,以利于进一步的修订。

本套教材虽为中专教材,但也注意到与全国执业药师资格考试有关内容的衔接,不仅适合于普通医药中专教学之需,也适合对在职人员进行中等职业培训及有志自学者学习之需。

竭诚欢迎广大读者提供宝贵意见。

全国普通医药中专教材建设委员会

1999 年 2 月

编写说明

本教材是在全国普通医药中专教材建设委员会的统一规划下编写的。本书编写的依据是原国家医药管理局科教司组织制订并于1997年7月颁布的《全日制普通医药中等专业学校指导性教学大纲汇编》。

全国医药中专多年来为医药行业输送了大批具有中等专业技术水平的专业人才。但在教学方面，长期以来都始终没有符合本专业要求的规范性教材。因此，编写合适的教材成了当务之急。这次参加本书编写的人员都是长期奋战在教学第一线、有丰富教学经验且专业知识水平较高的教师。他们熟悉教学、熟悉教材、熟悉学生。由他们编写的教材应能适合医药中专的教学。

本书所编写药物主要参照近年来有关主管部门组织遴选的国家基本药物名单，药名采用《中国药品通用名称》中所列的药品通用名。考虑到药学专业开设药物化学课程，故本书仅重点论述有代表性的药物构效关系，一般药物的化学结构式基本省去。

本教材由竺芝芬担任主编，苏怀德教授担任主审。本书编写人员及分工如下：李振新（山东省医药工业学校）编写第一章第一节至第三节及第三章；潘雪（北京市医药器械学校）编写第一章第四节及第二章；齐赤虹（河南省医药学校）编写第四章第一节至第五节；韩茹（安徽省医药学校）编写第四章第六节至第九节及第五章；陆艺（天津市药科中等专业学校）编写第六、七章；俞松林（浙江省医药学校）编写第八章；竺芝芬（浙江省医药学校）编写第九章。各人还负责编写同章的习题和实验。由竺芝芬拟定本书编写提纲，并负责全书的修改和统稿。

本书诚蒙国家药品监督管理局苏怀德教授的细心审阅，认真把关，并提出许多宝贵意见。在此深致谢意。

由于编者水平有限，编写药学中等专业教材又属初次尝试，缺乏经验，教材疏漏之处在所难免，恳请读者给予批评指正。

编者

1999年9月

目 录

第一章 总论	(1)
第一节 绪论	(1)
一、药理学的内容和任务	(1)
二、药理学的发展	(1)
三、药理学研究方法	(2)
第二节 药物对机体的作用——药效学	(3)
一、药物的基本作用	(3)
二、药物的构效关系与量效关系	(5)
三、药物作用机制	(6)
四、受体学说与药效学	(7)
第三节 机体对药物的作用——药动学	(9)
一、生物膜和药物的跨膜转运	(9)
二、药物的体内过程	(11)
三、血药浓度的动态变化	(15)
第四节 影响药物作用的因素	(17)
一、药物方面的因素	(17)
二、机体方面的因素	(19)
思考题	(20)
第二章 中枢神经系统药物	(21)
第一节 全身麻醉药	(21)
一、吸入麻醉药	(21)
二、静脉麻醉药	(23)
三、全麻药的给药方法	(24)
第二节 镇静催眠药	(24)
一、苯二氮草类	(24)
二、巴比妥类	(26)
三、其他镇静催眠药	(27)
第三节 抗癫痫、抗惊厥及抗帕金森病药	(28)
一、抗癫痫药	(28)
二、抗惊厥药	(31)
三、抗帕金森病药	(31)
第四节 抗精神失常药	(33)
一、抗精神病药	(33)
二、抗躁狂、抗抑郁症药	(36)

第五节 镇痛药	(37)
一、概述	(37)
二、阿片类镇痛药	(39)
三、其他合成镇痛药	(40)
第六节 解热镇痛抗炎药	(42)
一、概述	(42)
二、常用解热镇痛抗炎药	(43)
三、抗痛风药	(46)
第七节 中枢兴奋药	(46)
一、主要兴奋大脑皮层的药物	(46)
二、主要兴奋延脑呼吸中枢的药物	(47)
三、智能促进药	(47)
思考题	(48)
第三章 外周神经系统药物	(49)
第一节 传出神经系统药物概论	(49)
一、传出神经系统的解剖学分类	(49)
二、传出神经系统的递质及受体	(50)
三、传出神经系统药物的作用方式和分类	(53)
第二节 拟胆碱药与抗胆碱药	(54)
一、拟胆碱药	(54)
二、胆碱受体阻断药	(59)
第三节 拟肾上腺素药与肾上腺素受体阻断药	(63)
一、拟肾上腺素药	(63)
二、肾上腺素受体阻断药	(68)
第四节 局部麻醉药	(71)
一、局麻药应用方法	(71)
二、药理作用	(71)
三、常用局麻药	(72)
思考题	(73)
第四章 内脏系统药物	(74)
第一节 抗高血压药	(74)
一、概述	(74)
二、常用抗高血压药	(75)
三、抗高血压药的合理应用	(79)
第二节 强心甙	(80)
一、概述	(80)
二、强心甙	(80)
三、扩血管药的抗心衰作用	(84)
第三节 抗心律失常药	(85)

一、概述	(85)
二、常用抗心律失常药	(87)
三、抗心律失常药的合理应用	(91)
第四节 抗心绞痛及抗动脉粥样硬化药	(92)
一、抗心绞痛药	(92)
二、抗动脉粥样硬化药	(94)
第五节 利尿药及脱水药	(96)
一、利尿药的作用部位及分类	(97)
二、常用利尿药	(98)
三、脱水药	(101)
第六节 呼吸系统药物	(102)
一、镇咳药	(102)
二、祛痰药	(103)
三、平喘药	(104)
第七节 抗组胺药物	(107)
一、组胺及其受体效应	(107)
二、H ₁ 受体阻断药	(108)
三、H ₂ 受体阻断药	(109)
第八节 血液系统药物	(109)
一、抗贫血药	(109)
二、抗凝血药及促凝血药	(111)
三、血容量扩充药	(114)
第九节 消化系统药物	(115)
一、助消化药	(115)
二、治疗消化性溃疡药	(115)
三、泻药与止泻药	(119)
四、保肝利胆药	(120)
思考题	(121)
第五章 激素类药物	(122)
第一节 肾上腺皮质激素类药物	(122)
一、盐皮质激素	(122)
二、糖皮质激素	(122)
第二节 性激素及计划生育用药物	(126)
一、雌激素类药及抗雌激素类药	(126)
二、孕激素类药及抗孕激素类药	(127)
三、雄激素类药及蛋白同化激素类药	(129)
四、计划生育用药	(129)
第三节 甲状腺激素及抗甲状腺药物	(130)
一、甲状腺激素	(130)

二、抗甲状腺药·····	(132)
第四节 胰岛素和口服降血糖药物·····	(133)
一、胰岛素·····	(133)
二、口服降血糖药·····	(134)
思考题·····	(135)
第六章 抗病原微生物药物·····	(137)
第一节 概述·····	(137)
一、抗病原微生物药物的作用机理·····	(137)
二、抗药性的产生及产生机理·····	(138)
三、作用谱·····	(139)
第二节 β -内酰胺类抗生素·····	(139)
一、青霉素类·····	(139)
二、头孢菌素类·····	(143)
三、其他 β -内酰胺类·····	(145)
第三节 大环内酯类及林可霉素类抗生素·····	(146)
一、大环内酯类·····	(146)
二、林可霉素类·····	(147)
第四节 氨基甙类与多肽类抗生素·····	(148)
一、氨基甙类·····	(148)
二、多肽类·····	(151)
第五节 四环素类、氯霉素类抗生素·····	(151)
一、四环素类·····	(152)
二、氯霉素类·····	(153)
第六节 喹诺酮类及其他人工合成抗菌药·····	(154)
一、喹诺酮类·····	(154)
二、磺胺类·····	(156)
三、甲氧苄啶类·····	(159)
四、硝基咪唑类·····	(160)
五、小檗碱·····	(161)
第七节 抗真菌药物·····	(161)
一、多烯类·····	(161)
二、咪唑类·····	(162)
三、其他抗真菌药·····	(163)
第八节 抗结核病药及抗麻风病药·····	(163)
一、抗结核病药·····	(163)
二、抗麻风病药·····	(167)
思考题·····	(168)
第七章 抗寄生虫病药物·····	(169)
第一节 抗疟药·····	(169)

一、疟原虫生活史·····	(169)
二、抗疟药分类·····	(170)
第二节 抗阿米巴病药和抗滴虫病药·····	(173)
一、抗阿米巴病药·····	(173)
二、抗滴虫病药·····	(175)
第三节 抗血吸虫病药及抗丝虫病药·····	(175)
一、抗血吸虫病药·····	(175)
二、抗丝虫病药·····	(176)
第四节 驱肠虫药·····	(177)
一、广谱驱肠虫药·····	(177)
二、驱绦虫药·····	(177)
三、其他驱肠虫药·····	(178)
思考题·····	(178)
第八章 抗病毒、抗肿瘤及免疫药物·····	(179)
第一节 抗病毒药物·····	(179)
一、病毒简介·····	(179)
二、常用抗病毒药物·····	(179)
第二节 抗肿瘤药物·····	(181)
一、概述·····	(181)
二、抗恶性肿瘤药物的作用及分类·····	(181)
三、常用抗肿瘤药物·····	(183)
四、抗恶性肿瘤药物的合理应用·····	(188)
五、抗肿瘤药物研究进展·····	(189)
第三节 影响免疫功能的药物·····	(190)
一、免疫应答反应·····	(191)
二、免疫抑制剂·····	(191)
三、免疫调节剂·····	(192)
思考题·····	(194)
第九章 新药药理研究基础知识·····	(195)
第一节 新药的临床前研究·····	(196)
一、药效动力学研究·····	(196)
二、药代动力学研究·····	(196)
三、毒理学研究·····	(197)
第二节 新药的临床研究·····	(200)
一、临床试验·····	(200)
二、生物等效性试验·····	(202)
思考题·····	(202)

实验

实验一	药物剂量对药物作用的影响·····	(203)
实验二	给药途径对药物作用的影响·····	(203)
实验三	药酶诱导剂和抑制剂对药物作用的影响·····	(204)
实验四	传出神经系统药对瞳孔的影响·····	(205)
实验五	有机磷酸酯类的中毒及解救·····	(206)
实验六	普鲁卡因的传导麻醉作用·····	(207)
实验七	苯巴比妥钠的抗惊厥作用·····	(207)
实验八	氯丙嗪对小鼠电刺激的影响·····	(208)
实验九	利尿药对家兔的利尿作用·····	(209)
实验十	普鲁卡因 LD ₅₀ 的测定 ·····	(209)
实验十一	几种药物对血凝时间的影响·····	(211)
实验十二	地塞米松的抗炎作用 ·····	(212)
药名索引	·····	(214)
主要参考文献	·····	(220)

第一章 总 论

第一节 绪 论

一、药理学的内容和任务

药物 (drug, pharmakon) 是指可用于预防、治疗、诊断疾病或计划生育的物质。它是人类与疾病作斗争的重要武器。

药理学 (pharmacology) 是研究药物与机体间相互作用规律和原理的一门学科。主要研究下列两方面的问题:

(1) 药物效应动力学 (pharmacodynamics), 简称药效学, 研究药物与机体 (包括病原体) 作用的规律, 阐明药物防治疾病的原理。

(2) 药物代谢动力学 (pharmacokinetics), 简称药动学, 研究机体对药物处置的过程, 即药物在体内的吸收、分布、转化及排泄过程, 也即药物体内过程的动态变化及其规律, 特别是血药浓度与作用强度随时间变化的规律。

药理学的任务是运用基础医药学的理论知识, 如人体解剖生理学、生物化学、病理学、微生物学、免疫学和药物化学等理论, 阐明药物作用的原理, 为合理用药提供科学依据; 为寻找新药、开辟老药新用途和发掘祖国医药学遗产提供线索, 同时也有助于了解机体机能的生理生化过程的本质。

二、药理学的发展

药物的发展在人类历史上经历了漫长的岁月。早在公元 1 世纪前后, 我国劳动人民在前人积累的大量药物知识的基础上, 就出版了世界上第一部药物学著作《神农本草经》。该书收载药物 365 种, 并将其按疗效和毒性做了分类, 其中大部分药物至今仍应用, 如大黄导泻、麻黄止喘、常山治疟、饮酒止痛等。公元 659 年, 唐朝政府组织编写了《新修本草》, 收载药物 844 种, 该书是世界上最早由政府颁布的药典, 比西方最早的《纽伦堡药典》要早 883 年。明朝伟大医药学家李时珍以毕生精力对药物做实际调查、考证, 写成了 190 万字的药学巨著《本草纲目》, 该书对 1892 种药物的来源、形态、性味和功用做了详细的描述, 并附有大量插图和方剂, 提出了科学的药物分类法, 促进了祖国医药的发展。

以实验研究为基础的现代药理学始于 19 世纪, 当时药物学、化学和生理学的进展为药理学的兴起奠定了基础。药理学作为独立的学科应从德国 R. Buchheim (1820 ~ 1879) 算起。1846 年他建立了世界上最早的药理实验室, 次年被 Dorpat 大学任命为药理学教授并正式开设药理学课程。1856 年他出版了世界上第一本药理学教科书, 他也是世界上第一位药理学教授。1935 年德国 Domagk 发现磺胺类可以治疗细菌感染。1940

年英国 H. W. Florey 在 A. Fleming (1928 年) 研究的基础上, 从青霉菌培养液中分离出青霉素。1942 年青霉素用于临床, 以后各种抗生素不断发现并投入使用, 使人们对细菌感染疾病的治疗进入了一个崭新的时代, 并发展成药理学的重要分支——化学治疗学。

近年来, 随着分子生物学、生物化学、生物物理学、免疫学、生物统计学的迅速发展, 以及电子技术、同位素技术等先进实验手段在药理实验中的应用, 药理学也有了很大的发展, 对药物作用机制的研究, 由系统、器官深入到细胞、亚细胞、受体、分子和量子水平。随着药理学领域的不断扩展和深化, 产生了生化药理学、分子药理学、量子药理学、免疫药理学、神经精神药理学、遗传药理学、时辰药理学及临床药理学等新的分支学科。

我国现代药理学发展的历史虽然不长, 但在基本理论和新药研究方面取得了许多可喜的成就。例如, 在抗血吸虫病药物方面, 对沿用已久的酒石酸锑钾的药效学和药动学进行了更系统的研究, 制订了合理的治疗方案, 提高了疗效, 减少了中毒病例的发生; 同时研制了安全有效并可供口服的非锑剂抗血吸虫病药吡喹酮, 这些工作为治疗和消灭血吸虫病做出了突出贡献; 在理论上阐明了吗啡的镇痛作用部位在第三脑室周围和导水管周围灰质, 对镇痛药作用机理的探讨产生了重要影响; 在中草药的研究中, 对镇痛药罗通定、强心药铃兰毒甙、钙拮抗剂汉防己甲素及抗疟药青蒿素等进行了大量工作, 阐明其作用及作用机制, 为中西医药的结合起到了推动作用。此外, 药理工作者应用现代实验手段对活血化淤、补肾益气、清热解毒等中医理论进行了深入探讨和科学分析, 对祖国医药遗产的继承、利用和发展发挥了重要作用。

三、药理学研究方法

药理学研究方法发展很快, 种类繁多, 归结起来可分为如下三大类:

1. 实验药理学方法

(1) 离体实验 采用离体动物器官、组织或细胞, 研究药物的作用、作用部位、作用机理及药物代谢等。该方法可直接观察药物对靶器官的作用, 便于对药物的作用进行分析。

(2) 用麻醉动物研究药物的作用。其特点是除去了高级神经系统对药物作用的影响。

(3) 用健康不麻醉动物进行药效动力学和药代动力学的研究。近几年来, 随着遥控遥测技术的发展, 该方法更加完善。由于药物是用于人体的, 而人体是整体存在的, 故本方法更有实际意义。

(2) 和 (3) 都是在完整的机体上进行研究, 故称为“在体实验”。

2. 实验治疗学方法

实验治疗学方法是通过建立与临床病理改变相应的实验动物病理模型, 以观察药物对动物疾病的防治作用。大部分化学治疗药物、抗高血压药物及抗恶性肿瘤药等都可通过动物病理模型观察其药理作用。它是把药理研究与临床相联系的重要途径之一。

3. 临床药理学方法

临床药理学方法是以人体为对象, 直接研究药物的疗效、毒副作用及药动学等内

容。

在学习药理学基本理论的同时，也要掌握常用的药理实验方法及基本操作，注重培养学生分析问题解决问题的能力。

第二节 药物对机体的作用——药效学

一、药物的基本作用

(一) 药物作用的性质

药物作用 (drug action) 指药物与机体组织间的原发作用；药物效应 (drug effect) 是指药物作用所引起的机体器官原有机能的改变。前者是过程，后者是结果，但两者常互相通用。药物对机体的作用，主要是对生理功能的兴奋和抑制。凡能使机体生理、生化功能活动加强的称为兴奋 (stimulation)，可引起兴奋的药物称为兴奋药，如咖啡因可增强大脑皮层细胞的兴奋性，使人精神振奋；凡能引起机体生理生化功能活动减弱的称为抑制 (depression)，引起抑制的药物称为抑制药，如地西洋可降低中枢神经系统的兴奋性，产生镇静催眠的效果。在人体内，同一药物对不同组织器官可产生不同的作用。如吗啡对中枢神经系统有抑制作用，呈现镇静、镇痛、呼吸抑制效应；但对消化道平滑肌有兴奋作用；呈现止泻、便秘现象。

药物对病原体的作用，则主要是通过干扰病原体的代谢而抑制其生长繁殖。

(二) 药物作用的方式

1. 局部作用和全身作用

局部作用 (local action) 是指药物在吸收入血液以前在用药部位所产生的作用。如口服硫酸镁在肠道不易吸收，可有导泻作用；局部麻醉药注射于神经末梢或神经干周围，可阻断神经冲动的传导。

全身作用 (general action) 是指药物吸收入血液循环后分布到机体有关部位发挥作用，也称吸收作用或系统作用。如口服氯喹后出现的抗疟作用。

2. 直接作用和间接作用

直接作用 (direct action) 又称原发作用。如吗啡镇痛、青霉素抗菌、强心甙类药物作用于心脏等。

间接作用 (indirect action) 又称继发作用，是由直接作用所引起。如地高辛强心作用的结果，使肾血流量增加，尿量增多，则心脏性水肿的症状减轻或消除。

(三) 药物作用有选择性

一种药物对于机体各器官组织的作用并不是一样的，往往对某一个或几个器官组织的某些功能影响特别明显，而对其他器官组织则不明显，这就是药物作用的选择性。药物作用的选择性是药物分类的依据，药物作用选择性高是由于药物与组织的亲和力大，且组织细胞对药物的反应性高。选择性高的药物大多数药理活性较高，使用时针对性较强；选择性低的药物，作用范围广，应用时针对性不强，不良反应常较多。药物的选择性是相对的，不是绝对的。临床上产生单一作用的药物几乎没有。

(四) 药物作用有双重性

药物产生的防治疾病的作用称为治疗作用 (therapeutic action); 同时出现的与治疗无关且有时对病人不利的反应, 称为不良反应 (untoward reaction), 有些不良反应是药物固有效应的延伸。此即药物作用的双重性。

1. 治疗作用

(1) 对因治疗 是针对病因的治疗, 也称治本。如用化疗药物杀灭病原微生物, 以控制传染病。

(2) 对症治疗 是指用药物改善疾病的症状, 也称为治标。如用镇痛药止痛、用解热镇痛药使发热病人体温降至正常。一般, 对因治疗比对症治疗重要。但对一些严重危及病人生命的症状, 对症治疗的重要性并不亚于对因治疗。如骨折引起的剧痛可能导致休克, 及时应用镇痛药, 虽不能消除病因, 但可通过缓解疼痛而避免休克的发生。用药基本原则是急则治其标, 缓则治其本, 必要时应标本兼顾。

2. 不良反应

(1) 副作用 (side effect) 是指在治疗量时出现的与治疗目的无关的不适反应。一般都较轻微, 常难以避免。产生副作用的原因是药物选择性低, 作用范围广, 治疗时利用其中一个作用, 其他作用就成了副作用。随着治疗目的的不同, 副作用有时可以成为治疗作用, 如阿托品可抑制腺体分泌, 解除平滑肌痉挛, 加快心率等。在全身麻醉时利用它抑制腺体分泌的作用, 则松弛平滑肌引起腹胀或尿潴留就成了副作用。如利用其解痉作用时, 口干和心悸就成了副作用。许多药物的副作用常可设法纠正。如麻黄碱治疗支气管哮喘时有中枢兴奋作用, 可使病人失眠。同时服用苯二氮草类药物可纠正失眠。

(2) 毒性反应 (toxic effect) 是指用药剂量过大或用药时间过长引起的机体损害性反应。毒性反应在性质和程度上与副作用均不同。通常对病人危害大, 有时可致不可逆功能变化, 但常可预知, 如果注意用药剂量和疗程及定时检查有关的生理、生化指标, 也是可以避免的。因服用剂量过大而立即发生的毒性反应, 称为急性毒性反应; 因长期服用后逐渐发生的药物毒性反应, 称慢性毒性反应。毒性反应的表现主要是对中枢神经、消化、血液、循环系统以及肝、肾功能造成功能性或器质性损害, 甚至可危及生命。在临床上应该注意掌握用药的剂量和间隔时间, 必要时应停药或改用其他药物。

(3) 变态反应 (allergy) 是机体受药物刺激后所发生的异常免疫反应, 可引起生理功能障碍或组织损伤, 称为变态反应。变态反应的发生与药物剂量无关或关系甚少, 治疗量或极少量都可发生; 变态反应仅见于少数过敏体质的病人; 变态反应性质各不相同, 不易预知, 如微量青霉素就可能引起过敏性休克。致敏原可能是药物本身或药物在体内的代谢物, 甚至是药物制剂中的杂质。如遇易致过敏的药物或过敏体质的病人, 用药前应进行过敏试验, 阳性反应者禁用。

(4) 继发性反应 (secondary reaction) 是指由于药物的治疗作用所引起的不良后果, 又称治疗矛盾。如长期应用四环素类广谱抗生素时, 可引起二重感染。

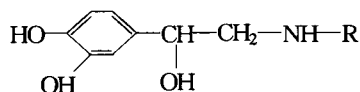
(5) 致畸和致癌作用 (teratogenic and carcinogenic effect) 有些药物能影响胚胎的正常发育而引起畸胎。在妊娠的头 3 个月内, 胚胎发育分化很快, 最易受药物影响, 故在用药时应特别慎重。有些药物长期应用也可能致细胞突变, 甚至癌变, 如环磷酰胺可致白血病、膀胱癌。

二、药物的构效关系与量效关系

1. 药物的构效关系

许多药物的药理作用特异性取决于特异的化学结构。一般，结构类似的化合物能与同一酶或受体结合，产生激动作用。取代基团渐增大，内在活性渐减弱，逐渐变成部分激动剂或拮抗剂，见表 1-1。

表 1-1 去甲肾上腺素衍生物的内在活性和亲和力的比较



药 物	R	内 在 活 性		亲 和 力		
		α 作用特异性	非特异性	激动	拮抗	部分激动
去甲肾上腺素	H	1		5.1		
肾上腺素	CH ₃	1		5.6		
异丙肾上腺素	CH(CH ₃) ₂	0.4		4.5		
药物 A	C ₄ H ₉		-1			2.0
药物 B	CH ₂ -CH ₂ -C ₆ H ₅ CH ₃	0			5.0	

有时药物的结构式相同，但其不同的光学异构体的药理作用可能不相同。如奎宁为左旋体，有抗疟作用；而奎尼丁为其右旋体，有抗心律失常作用；氯霉素仅左旋体有抗菌作用等。

2. 药物的量效关系

在一定范围内，药物剂量大小与其血药浓度高低成正比，亦与药效的强弱有关。用药剂太小往往无效，剂量太大又会出现中毒症状。量效关系研究是定量地分析阐明药物的剂量与效应之间的规律。这既有助于了解药物作用的性质，也可为临床用药提供参考。

药物的量效关系可用量效曲线表示，根据所观察的药理效应指标的不同，可分为量反应和质反应。

(1) 量反应 药理效应的高低或多少可用数字或量的分级表示其作用强度者称为量反应。如心率、血压、血糖浓度、尿量、平滑肌舒缩等。以剂量为横坐标，以效应为纵坐标作图（图 1-1）。

曲线表示：随着剂量增加，效应强度相应增加，直至出现最大效应，亦称药物效能，用 E_{\max} 表示。图中 A、B 两药的 E_{\max} 不同， E_{\max} 表示药物随剂量增加所获得效应的最大值。他的大小，取决于药物本身的内在活性和药理作用特点。如以效能大小评价药物作用强弱时，应注意药物的不良反应。为保证用药安全有效，应考虑采用产生最大效应剂量时是否会出现毒性反应。量效曲线在横轴（剂量轴）上的位置反应药物的作用强度，称为效价或效价强度，他表示药物达到一定效应时所需的相对应的剂量或浓度。所以，A、B 两药的作用强度大小，可比较产生相等 E_{\max} 所需剂量的大小，其强度与所需剂量大小成反比。