

全国高等医药院校试用教材

(供药学、中药专业用)

药理学

上册

上海第一医学院 主编



人民卫生出版社

全国高等医药院校试用教材

(供药学、中药专业用)

药 理 学

上 册

主 编 单 位

上海第一医学院

编 写 单 位

北京医学院药学系 南 京 药 学 院

四川医学院药学系 沈 阳 药 学 院

江 西 中 医 学 院 上海第一医学院药学系

人 民 卫 生 出 版 社

药 理 学

(上 册)

上 海 第 一 医 学 院 主 编

人 民 卫 生 出 版 社 出 版

人 民 卫 生 出 版 社 印 刷 厂 印 刷

新 华 书 店 北 京 发 行 所 发 行

787×1092毫米16开本 18印张 406千字

1979年11月第1版第1次印刷

印数：1—20,200

统一书号：14048·3765 定价：1.40元

编写说明

本书是供药学院系各专业、中医学院中药专业以及抗菌素专业使用的统编教材。药理学课程是一门重要的专业基础课,为了使 学生掌握现代药学的新理论和新概念,必须使 他们具备药理学的基本理论、基本知识和基本技能。

编写和审订本书,力求贯彻卫生部教材会议精神,努力反映本学科国内外的新进展,使本书内容适应当前我国药学教育事业的需要。但考虑到目前的实际情况和便于教学,本书用大字排印主要内容,用小字排印参考内容。教师可根据实际情况和教学大纲要求组织教学。

为适应专业特点,紧密结合专业需要强调培养学生评价和发展新药的能力,本书特新设第七篇“新药的药理研究及评价”。

本书由卫生部组织北京医学院药学系、南京药学院、四川医学院药学系、沈阳药学院、江西中医学院及上海第一医学院药学系共同协作编写。初稿自 1977 年 11 月开始编写,于 1978 年 11 月讨论定稿。在审订过程中除各单位编写人员参加外,还特邀遵义医学院张毅教授、上海中医学院王筠默副教授、浙江医科大学药学系章元沛副教授、中国人民解放军第二军医大学药学系龙焜副教授、山东医学院于常平老师等参加了审稿讨论工作,上海第一医学院杨藻宸教授、上海第二医学院金正均副教授也应邀参加了部分审订工作,并提供了宝贵的修改意见。上海第一医学院药学系药理生化组陈滨凌同志以及绘图室陆霞同志也做了不少具体工作,使本书的编写审订工作得以顺利进行,在此向他们表示深切的谢意。

由于编写整理时间仓促,水平有限,本书定会存在不少缺点和欠妥之处,务请使用本书的师生指正,以备再版时修改。

药 学 系 药 理 学 教 材 编 写 组

1979 年 3 月

目 录

第一篇 总论	1
第一章 绪言	1
第二章 药物的作用与作用机理	3
第一节 药物的作用	3
第二节 药物作用的基本规律	3
一、药物作用的选择性	3
二、药物作用的两重性（防治作用与不良反应）	4
三、药物的构效关系	6
四、药物的量效关系	8
第三节 药物作用的机理	9
一、概述	9
二、受体学说	9
第三章 药物的转运与转化	14
第一节 生物膜与药物的转运	15
一、生物膜的结构与功能	15
二、细胞膜转运药物的机理	16
第二节 吸收、分布与其影响因素	18
一、影响吸收的因素	18
二、影响分布的因素	21
第三节 药物的生物转化	21
一、代谢转化的类型	22
二、药物代谢酶，简称“药酶”	24
第四节 药物的排泄	25
第五节 量时关系与时效关系	25
第四章 影响药物作用的因素	28
第一节 药物方面的因素	29
一、剂量	29
二、剂型	29
三、制剂	30
第二节 环境因素	31
一、外环境	31
二、内环境	31
三、病理状态	33
四、药物的相互作用	33
第三节 遗传因素	34
一、药物代谢障碍所致的毒性反应	34
二、对药物敏感性的增高	35
三、由遗传缺陷所出现的异常药物作用	35

四、对药物反应性的减低·····	35
五、药物的异常分布·····	35
六、对药物反应的种族差异·····	35
第二篇 主要作用于中枢神经系统的药物 ·····	36
第五章 全身麻醉药 ·····	36
第一节 概述·····	36
一、全身麻醉药的作用原理·····	36
二、麻醉分期·····	37
第二节 吸入全麻药·····	38
麻醉乙醚(38) 氟烷(38) 甲氧氟烷(39)	
第三节 静脉麻醉药·····	39
硫喷妥钠(39) 氯胺酮(39) 羟丁酸钠(40)	
第四节 全身麻醉时的合并用药·····	41
第五节 中药麻醉·····	41
第六章 催眠药与镇静药 ·····	42
第一节 巴比妥类·····	42
巴比妥(43) 苯巴比妥(43) 异戊巴比妥(43) 司可巴比妥(43) 环己巴比妥(43) 硫喷妥(43)	
第二节 苯二氮革类·····	47
利眠宁(47) 安定(47) 去甲羟基安定(48) 硝基安定(48)	
第三节 丙二醇甲酸酯类·····	48
安宁(48)	
第四节 醛类·····	48
水合氯醛(48) 副醛(48)	
第五节 其他·····	49
安泰乐(49) 芬那露(49) 导眠能(49) 瓦尔米(50) 安眠酮(50)	
第六节 溴化物·····	50
溴化钠(50) 溴化钾(50) 溴化铵(50)	
第七节 中草药·····	50
酸枣仁(50) 夜交藤(51) 远志(51) 缬草(51)	
第七章 抗癫痫药与抗惊厥药 ·····	52
第一节 抗癫痫药·····	52
苯妥英钠(53) 苯巴比妥(54) 去氧苯比妥(54) 三甲双酮(55) 乙琥胺(55) 安定(55)	
第二节 抗惊厥药·····	55
硫酸镁(55)	
第三节 中草药·····	56
天麻(56) 钩藤(56) 蜈蚣(56) 全蝎(56)	
第八章 抗精神失常药 ·····	57
第一节 抗精神病药·····	57
一、吩噻嗪类·····	58
氯丙嗪(58) 丙嗪(58) 三氟丙嗪(58) 甲哌氯丙嗪(58) 三氟拉嗪(58)	

甲哌硫丙嗪(58) 乙酰奋乃静(58) 奋乃静(58) 氟奋乃静(58) 甲硫达嗪(58)	
二、噻吨类·····	61
泰尔登(62)	
三、丁酰苯类·····	62
氟哌啶醇(62) 氟哌啶(62)	
四、二苯氮卓类·····	63
氯氮平(63) 氯噻平(63)	
五、碳酸锂·····	63
第二节 抗忧郁症药·····	64
一、三环类·····	64
丙咪嗪(64) 去甲丙咪嗪(64) 氯丙咪嗪(64) 阿密替林(64) 多虑平(65)	
二、单胺氧化酶抑制剂·····	65
苯乙肼(65) 异噁唑酞肼(65) 苯环丙胺(65)	
第九章 镇痛药·····	67
第一节 阿片生物碱类镇痛药·····	68
吗啡(68) 可待因(71)	
第二节 吗啡代用品及构效关系·····	71
一、纯粹镇痛剂·····	73
哌替啶(73) 美散痛(73) 芬太尼(74)	
二、混合型激动拮抗剂·····	74
镇痛新(74) 丙烯吗啡(74)	
三、纯粹拮抗剂·····	74
纳洛酮(74)	
第三节 中草药·····	75
延胡索(75) 延胡索乙素(75) 七叶莲(75)	
第十章 解热镇痛药与抗痛风药·····	76
第一节 解热镇痛药·····	76
一、水杨酸类·····	78
阿司匹林(78) 水杨酸钠(79)	
二、苯胺类·····	79
非那西丁(79) 对乙酰氨基酚(79)	
三、吡唑酮类·····	80
氨基比林(81) 安乃近(81) 保泰松(81) 羟基保泰松(81) 磺吡拉宗(81)	
四、有机酸类等非甾体类抗炎药·····	81
氟灭酸(82) 甲灭酸(82) 氯灭酸(82) 甲氯灭酸(82) 布洛芬(82) 消炎痛(82) 炎痛静(82)	
五、中草药·····	83
柴胡(83) 葛根(83) 麻黄(83) 细辛(84) 黄芩(84) 汉防己(84) 秦艽(84) 牡丹皮及徐长卿(84)	
第二节 抗痛风药·····	84
丙磺舒(85) 别嘌呤醇(85)	

第十一章 中枢兴奋药	37
第一节 大脑精神兴奋药	88
咖啡因类(咖啡因、茶碱、柯柯碱)	88
第二节 脑干呼吸兴奋药	89
一、直接兴奋脑干	89
戊四氮(89) 美解眠(89) 氟乙醚(89) 尼可刹米(90) 多普兰(90) 回苏灵(90)	
二、反射性兴奋延脑呼吸中枢	90
山梗菜碱(90) 野靛碱(90) 乙酰胺奋(90)	
第三节 脊髓兴奋药	91
土的宁(91) 叶萩碱(91)	
第四节 促进脑细胞代谢、提高中枢兴奋性药	92
氯酯醒(92) 克脑迷(92)	
第五节 中草药	92
人参(92) 刺五加(92) 五味子(92)	
第三篇 主要作用于植物神经系统的药物	94
第十二章 局部麻醉药	94
第一节 局部麻醉药的应用方法	94
第二节 化学结构与作用关系	95
第三节 作用机理	96
第四节 常用的局部麻醉药	96
普鲁卡因(96) 丁卡因(97) 利多卡因(98)	
第五节 其它局部麻醉药	99
沙夫卡因(99) 勃底伏卡因(99) 丙胺卡因(99) 卡波卡因(99) 苯佐卡因(99) 苯甲醇(99)	
第十三章 作用于传出神经系统的药物概论	100
一、传出神经系统的解剖分类	100
二、传出神经系统的化学传递	102
三、传出神经系统按递质分类	103
四、传出神经系统效应器上的受体	104
五、传出神经系统的生理功能	104
六、传出神经系统药物的作用方式与分类	106
第十四章 拟胆碱药	107
第一节 乙酰胆碱	107
第二节 直接与胆碱受体结合的拟胆碱药	109
一、完全拟似药	109
氮甲酰胆碱(109) 槟榔碱(110)	
二、M-受体兴奋药	110
毛果芸香碱(110)	
三、N-受体兴奋药	111
烟碱(111)	
第三节 抗胆碱酯酶药	112
一、易逆性抗胆碱酯酶药	112

毒扁豆碱(112) 新斯的明(113) 吡啶斯的明(114) 加兰他敏(114) 酶抑 宁(114) 腾喜龙(114)	
二、难逆性抗胆碱酯酶药	115
有机磷酸酯类	115
附:胆碱酯酶复能剂	117
解磷定(117) 氯磷定(118) 双复磷(118)	
第十五章 抗胆碱药	119
第一节 平滑肌解痉药	120
一、阿托品与阿托品类生物碱	120
阿托品(120) 东莨菪碱(121) 山莨菪碱(122) 樟柳碱(122)	
二、阿托品类的构效关系与其合成代用品	122
后马托品(123) 伏卡托品(123)	
第二节 神经节阻断药	125
第三节 骨骼肌松弛药	125
一、非去极化型肌松药	127
筒箭毒碱(127) 潘寇罗宁(127)	
二、去极化型肌松药	127
琥珀酰胆碱(127)	
三、中草药	128
汉肌松(128) 傣肌松(128) 八角枫碱(128)	
第四节 抗震颤麻痹药	129
一、中枢性抗胆碱药	129
苯托品(129) 苯海索(129) 安克痉(129) 卡马特灵(129)	
二、多巴胺类	130
左旋多巴(130) 金刚烷胺(131) 溴隐亭(131)	
第十六章 拟肾上腺素药	132
第一节 去甲肾上腺素与肾上腺素的生物合成、贮存、释放、摄取及代谢	132
第二节 肾上腺素受体的分类	134
第三节 拟肾上腺素药的分类	135
一、 α 、 β -受体混合兴奋剂	135
肾上腺素(135) 麻黄碱(138) 多巴胺(139)	
二、 α -受体兴奋剂	139
去甲肾上腺素(139) 间羟胺(140) 苯肾上腺素(141) 甲氧胺(141)	
三、 β -受体兴奋剂	141
异丙肾上腺素(141) 甲苯丁胺(143) 舒喘灵(143) 间羟舒喘宁(143)	
四、拟肾上腺素药化学结构与作用关系	144
第十七章 抗肾上腺素药	145
第一节 α -受体阻断剂	145
一、短效类 α -受体阻断剂	146
妥拉苏林(146) 酚妥拉明(146)	
二、长效类 α -受体阻断剂	146
酚苄明(146) 氢化麦角碱(147)	
第二节 β -受体阻断剂	147

二氟异丙肾上腺素(149) 蔡心定(149) 甲苯心安(149) 心得平(149) 心得舒(149) 心得静(149) 心得安(149) 丁心定(149) 硝苯心定(150) 甲磺胺心定(150) 噻吗心胺(150) 心得宁(150) 心得乐(150)

第四篇 主要作用于内脏系统的药物152

第十八章 抗高血压药152

第一节 影响肾上腺素能神经末梢递质的降压药153

利血平(153) 降压灵(154) 胍乙啶(154) 胍生(155) 胍氯酚(155)

第二节 直接扩张小动脉的降压药155

肼苯噻嗪(155) 双肼苯噻嗪(156) 长压定(156) 氢氯噻嗪(156) 地巴唑(157) 硝普钠(157)

第三节 中枢性降压药157

可乐宁(158) 甲基多巴(158)

第四节 神经节阻断药158

六羟季铵(159) 美加明(159) 潘必定(159) 阿方那特(159) 安血定(159)

第五节 β -受体阻断药160

心得安(160)

第六节 其它降压药160

降压嗪(160) 优降宁(161)

第七节 中草药161

汉防己(161) 臭梧桐叶(162) 青木香(162) 野菊花(162) 杜仲(162) 罗布麻(162)

第八节 降压药的选择与合并用药163

第十九章 强心甙165

第一节 心力衰竭概述165

第二节 强心甙166

洋地黄(166) 洋地黄毒甙(172) 地高辛(172) 西地兰(173) 毒毛旋花子甙K(173)

第二十章 抗心律失常药176

第一节 心律失常概述176

一、心律失常176

二、心肌电生理177

第二节 抗心律失常药物181

奎尼丁(182) 普鲁卡因酰胺(183) 利多卡因(183) 慢心利(184) 苯妥英钠(184) 心得安(185) 心得宁(186) 溴苄胺(186) 钾盐(187) 异搏定(187) 安替司丁(188) 双异丙吡胺(188)

第二十一章 抗心绞痛药190

第一节 亚硝酸和硝酸酯类191

第二节 β -受体阻断剂193

心得安(194) 心得宁(194)

第三节 冠脉扩张剂194

一、香豆素类195

乙胺香豆素(195)

二、腺苷类195

双丁酰环磷腺苷(195)	
三、克冠酸类·····	196
克冠二胺(196)	
四、其它·····	196
心可定(196) 硝苯吡啶(197) 双环己哌啶(197)	
第四节 中草药(197)	
丹参(198) 葛根(198) 银杏叶(198) 瓜蒌(199) 淫羊藿(199) 毛冬青(199)	
冠心Ⅱ号(199)	
第二十二章 降血脂药·····	201
第一节 抑制脂质转运的降血脂药·····	202
一、安妥明类·····	202
安妥明(202) 安妥明铝盐(203) 安妥明丙二醇酯(204) 降脂酰胺(204)	
二、烟酸类·····	204
烟酸(204) 烟酸肌醇酯(205)	
第二节 抑制胆固醇吸收的降血脂药·····	205
消胆胺(205)	
第三节 不饱和脂肪酸类·····	206
第四节 降血脂中草药·····	207
何首乌(207) 决明子(207) 虎杖(207) 山楂(208) 泽泻(208)	
第二十三章 利尿药和脱水药·····	209
第一节 利尿药作用的生理学基础·····	209
第二节 各类利尿药·····	212
一、远曲长效类·····	212
双氢氯噻嗪(212) 氯噻酮(214)	
二、升支强效类·····	214
利尿酸(215) 速尿(215) 丁苯氧酸(215) 汞撒利(215)	
三、远曲留钾类·····	216
安体舒通(216) 氨苯喋啶(217)	
四、中草药类·····	218
车前(218) 半边莲(218) 猪苓(218) 藟蓄(218)	
第三节 利尿药的临床应用·····	218
第四节 脱水药·····	219
甘露醇(219) 山梨醇(220) 葡萄糖(220)	
第二十四章 主要作用于呼吸系统的药物·····	221
第一节 镇咳药·····	221
一、中枢性镇咳药·····	221
可待因(221) 咳必清(222) 咳平(222) 苦杏仁(222) 紫花杜鹃(223) 矮	
地茶(223)	
二、末梢性镇咳药·····	224
退嗽(224) 咳宁(224) 甘草及糖浆(224)	
第二节 祛痰药·····	224
一、恶心性祛痰药·····	225
氯化铵(225) 桔梗(225) 远志(225) 吐根(225)	

二、刺激性祛痰药·····	225
三、粘痰溶解剂·····	226
必消痰(226) 痰易净(226) 满山红(227)	
第三节 平喘药·····	227
一、 β -受体兴奋药·····	228
肾上腺素(228) 异丙肾上腺素(228) 麻黄碱(228) 舒喘灵(228) 喘咳宁(228)	
喘速宁(229) 邻氯喘息定(229) 间羟叔丁肾上腺素(229)	
二、直接松弛支气管平滑肌的药物·····	229
氨茶碱(229) 喘定(230) 芸香草(230) 地龙(231)	
三、抗过敏药·····	231
糖皮质激素类药物(231) 艾叶油(231) 色甘酸钠(232)	
四、M-受体阻断剂·····	232
异丙阿托品(233) 热参(233) 洋金花(233)	
第二十五章 主要作用于消化系统的药物·····	235
第一节 助消化药·····	235
稀盐酸(235) 胃蛋白酶(235) 胰酶(236) 乳酶生(236) 干酵母(236) 神曲(236)	
山楂(236) 麦芽(236) 鸡内金(237)	
第二节 抗酸药·····	237
一、易吸收性抗酸药·····	237
碳酸氢钠(237)	
二、难吸收性抗酸药·····	238
氧化镁(238) 三硅酸镁(238) 碳酸钙(238) 氢氧化铝(238)	
第三节 其它治疗消化性溃疡药·····	239
生胃酮(239) 硫糖铝(239) 胃粘膜素(239) 维生素U(239)	
第四节 泻药·····	240
一、盐类泻药·····	240
硫酸镁(240) 硫酸钠(241)	
二、化学刺激性泻药·····	241
酚酞(241) 双醋酚汀(241) 三醋酚汀(241) 大黄(242) 蓖麻油(242)	
三、润滑性泻药·····	242
液体石蜡(243) 火麻仁(243) 郁李仁(243)	
四、应用注意点·····	243
第五节 止泻药·····	243
一、吸附收敛止泻药·····	243
鞣酸蛋白(244) 次碳酸铋(244) 药用炭(244)	
二、减少肠蠕动止泻药·····	244
苯乙哌啶(244)	
第六节 利胆药·····	245
牛胆酸钠(245) 去氢胆酸(245)	
第七节 治疗肝胆疾病的辅助药·····	245
一、趋脂药·····	245
胆碱(245) 蛋氨酸(246) 肌醇(246)	
二、降血氨药·····	246

谷氨酸(247) γ -氨基丁酸(247)	
三、肝脏解毒功能辅助药	247
肝泰乐(247) 维丙肝(248) 乳果糖(248)	
四、中草药	248
茵陈蒿(248) 五味子(249) 水飞蓟(249) 田基黄(250) 垂盆草(250)	
第二十六章 主要作用于血液及造血系统的药物	251
第一节 抗贫血药	251
一、铁制剂	252
硫酸亚铁(254) 枸橼酸铁铵(254) 富马酸铁(254) 右旋糖酐铁(254) 山梨醇铁(254)	
二、叶酸类	254
叶酸(254)	
三、维生素B ₁₂	255
第二节 升白细胞药	257
维生素B ₆ (257) 肌苷(257) 鲨肝醇(258) 利血生(258) 白血生(258)	
第三节 止血药与抗凝血药	259
一、止血药	259
I、促进血液凝固过程的药	259
维生素K(259) 止血敏(260) 凝血质(261)	
II、抗纤维蛋白溶解的止血药	261
6-氨基己酸(261) 对氨基苯甲酸(261) 止血环酸(261)	
III、其它	262
安特诺新(262) 脑垂体后叶素(262) 仙鹤草素(262) 三七(262) 紫珠草(263)	
牛西西(263)	
二、抗凝血药	263
肝素(263) 双香豆素及其衍生物(264) 新抗凝(264) 枸橼酸钠(264)	
三、几种与血凝有关的酶制剂	265
溶栓酶(265) 抑肽酶(265) 糜蛋白酶(265) 透明质酸酶(265) 菠萝蛋白酶(266)	
第四节 血容量扩充剂	267
右旋糖酐(267) 聚乙烯吡咯酮(268) 706代血浆(268)	
第二十七章 作用于子宫的药物	269
催产素与抗利尿激素	269
催产素(270) 脑垂体后叶素(271) 麦角制剂(麦角胺、麦角毒、麦角新碱)(271)	
前列腺素(273) 益母草(273) 红花(273) 当归(274)	

第一篇 总 论

第一章 绪 言

药理学 (Pharmacology) 是研究药物与机体相互作用的一门科学。它所要阐明的, 不仅是药物对人体与病原体的作用和作用机理; 而且要研究人体与病原体对药物的反作用 (体内过程), 前者属于药效动力学 (Pharmacodynamics), 后者属于药代动力学 (Pharmacokinetics) 的范围。药理学既是基础医学与临床医学之间的一座桥梁, 也是医学与药学之间的桥梁科学。药理学研究对正确用药, 提高药物防病治病效果, 促进医学、药学的发展, 协同其它生物科学阐明生命活动的基本规律, 都有着极大的重要性。

在学习药理学过程中, 我们必须运用辩证唯物主义的观点和方法: 一方面, 在理论上探讨药物的治疗作用与不良反应及其发生机理, 以及化学结构与这些作用的关系, 在技术上学习研究这些问题的基本方法, 以为今后正确地研制药剂, 寻找高效低毒的新药, 打下可靠基础。

中国的医药学具有数千年的历史, 在防治疾病中作出了巨大贡献。我国的中草药蕴藏量相当丰富, 如何运用现代科学知识对中草药进行研究, 加以整理与提高, 是关系到创建我国新医学与新药学的重大问题。今后的中草药研究, 不但要注意单味中草药的提取与筛选, 还应当尽一切可能, 采用新的生物科学方法开展研究, 以求在中草药的作用机理上有新的突破。

药物的发展史与人类的发展史同样悠久。原始人类在与自然作斗争的过程中, 为了寻找食物, 常常试尝各种叶、草、根、果。这样, 必然会遇到一些有特殊作用, 例如, 泻下、致吐、镇痛、止血等作用的物质。以后当人们发生疾病的时候, 就会根据经验利用这些物质来治病。这样, 经过反复实践, 其中某些物质就成为药物。因此凡能用于疾病的预防、治疗与诊断以及能使机体的功能发生某种变化的物质, 都可称为药物 (Drug 或 Pharmakon)。早在公元一世纪, 我国即有《神农本草经》, 载有各种动、植、矿物药共 365 种, 其中有不少仍流传到现在, 如人参、甘草、当归、麻黄、大黄、楝实等。这是我国第一部比较完整而重要的药物学著作, 总结了古代应用药物的知识, 托神农之名问世。此后, 又有不少人对本草进行了不断的增补与修订, 使其愈臻完善。较突出的有公元七世纪唐代的《新修本草》, 公元十二世纪宋代的《证类本草》, 十六世纪明代的《本草纲目》。在这些著作中, 唐代的《新修本草》是我国第一部由政府颁布的药典, 比西方所谓最早的纽伦堡药典要早 883 年。全书共收药 884 种。明朝李时珍的《本草纲目》是闻名世界的一部巨著。李时珍自 1552 年起, 以《证类本草》为蓝本, 参考历史书籍, 深入各地采访, 加上他自己多年行医的经验, 系统而比较全面地总结了我国劳动人民在十六世纪以前的用药经验, 共收药 1,892 种, 附方 11,096 条, 提出了科学的药物分类法, 历时 26 年, 于 1578 年完成了 52 卷, 约 200 万言的巨著, 具有重大的学术价

值和实用价值。不仅对我国药学的发展有重大的历史意义和现实意义，而且对世界药学的发展起了推动作用。已译成英、日、德、法、俄、拉丁等外国文本传播世界，成为世界性的重要药学文献之一。

药理学的建立和发展与现代科学技术的发展具有密切的联系。在西方，有关药物的知识，起初也仅仅停留在药理学（Materia Medica）的阶段。只涉及药物性状的叙述、作用的表现及其治疗应用。直到19世纪初，由于现代实验生理学与化学的兴起，出现用新的方法分离提取生药有效成分、合成新化合物以及用实验方法探讨药物作用的新阶段。这样，为形成和建立现代药理学打下了基础。吗啡就是1806年第一个由生药中分离出来的有效成分。随着有机化学结构的研究，合成了一系列新的化合物，例如有机砷化合物的合成。实验药理学的建立为研究这些新药的作用提供了条件。德国R. Buchheim于1847年首先创建药理实验室并出版第一本药理学教科书。第一部药理学杂志亦于1870年后创刊。此后相继在德国及其他西方各国建立实验药理学部门。药理学的逐步发展不但为临床用药提供了理论依据，也为毒理学、公共卫生学、兽医学等方面的有关理论问题提供了参考资料。

药理学对生理与生物化学的贡献也很重要。许多生理学问题由于应用了化学药品而得以解决。例如Loewi及Dale对于神经兴奋过程中化学传递物质的发现，化学感受器反射性功能的确定，以及发现 α 及 β 受体阻断药物等等，对于解决生理与生化问题、阐明生命活动的基本规律，起了很大作用。近年来，药理学由过去的一门生理科学发展成为与生物物理、生物化学、分子生物学更为密切联系的一门科学。由于这样，药物作用机理的研究，由宏观世界进入微观世界、由原来的系统、器官水平进入细胞、亚细胞、甚至分子与量子水平。出现了新的分支如生化药理学（Biochemical Pharmacology）、分子药理学（Molecular Pharmacology）、药物遗传学（Pharmacogenetics）同时与临床医学的关系也更加密切了，临床药理学（Clinical Pharmacology）现已成为一门重要的新兴学科。随着科学的不断发展，新学科的不断兴起，药理学的理论知识和研究技术将向纵深推进，为阐明生命活动的规律作出更大贡献。

我国解放前，由于反动统治和帝国主义的侵略，科学技术落后，中医中药受到歧视。直到50余年前才开始设立药理学课程，药理学工作者亦寥寥无几。40余年前才开始设置药科，培养制药人材。新中国成立后，药理研究工作逐步得到发展，药理学工作者的队伍也逐渐壮大。中医中药的研究，更是受到了前所未有的重视。曾经呈现出一派兴旺发达的景象。例如对于危害人民健康的血吸虫病的防治，动员了广大科研人员，一方面为寻找高效低毒而且可以口服的药物，作出了一定的成绩；另一方面，对沿用已久的酒石酸锑钾的药效动力学及药代动力学进行了更系统的研究，为制订合理的治疗方案以提高疗效、减少中毒病例的发生，作出了成绩。又如在理论上对吗啡的镇痛作用部位，已由我国药理学工作者证明在第三脑室周围。在中草药的研究中，对强心甙、抗高血压药、肌松药、抗心绞痛药，都曾作过或正在进行系统而深入的研究。从而为中西医结合，起了推动作用。当前在社会主义建设新时期总任务的鼓舞下，广大药理工作者和全国人民一起，正在奋发图强，努力学习先进的科学技术，为中西医结合，为建立并发展药理学本门学科的各个分支科学，为早日实现祖国的四个现代化，作出应有的贡献。

（上海第一医学院 易鸿匹）

第二章 药物的作用与作用机理

第一节 药物的作用

药物主要是用来预防和治疗疾病的。其中有的可用以提高或降低人体的生理生化功能，使患病机体遭受紊乱的功能得到纠正；有的可用以补偿体内某些必需物质的不足，使某些缺乏机体必需物质的病症获得痊愈；还有的可用来抑制或杀灭致病寄生虫或微生物，以协助机体防卫功能战胜感染。

药物只能使机体原有的生理、生化机能发生改变而决不能产生新的功能。凡能使机体功能增强的称为兴奋作用，反之，则称为抑制作用。例如，催眠药可降低人或动物的中枢神经系统的兴奋性而使之入睡。咖啡因则可提高其兴奋性从而驱除其睡意。因此前者称为中枢抑制药，后者则称为中枢兴奋药。其他如腺体的分泌、心脏的跳动、胃肠道的蠕动以及酶的活性等等都可用相应的药物以增强或减弱其功能。但应注意，量变可以引起质变，中枢兴奋药如用量过大可由兴奋转入抑制。此外同一药物在同一机体内可以对某些系统、器官或组织引起兴奋而对另一些却为抑制。如肾上腺素抑制支气管平滑肌的收缩，解除其痉挛，缓解哮喘，但对心肌却使收缩加强，心跳加速。

化疗药就是选择性干扰病原体代谢系统，而发挥其抑制或杀灭作用。除抗肿瘤药外，一般对机体的代谢系统无明显的干扰。但在药物发挥作用的基础上，疾病的最终痊愈仍有赖于机体本身的免疫力或抵抗力。

凡在用药局部起作用而不对全身起作用的称为局部作用，最简单的例子为皮肤或粘膜表面用药以防治局部创伤的感染。但吸收作用则不同，药物必须自用药部位吸收入血后再发挥作用。大多数经由口服或注射给药的药物都需吸收进入血液循环，随后才发生作用的，此属吸收作用的范围。

第二节 药物作用的基本规律

一、药物作用的选择性

药物对于人体，不是对所有的器官、组织都一样发生作用，往往只是对某些器官或组织发生明显作用而对其他器官或组织则没有作用或没有明显作用。同样，化疗药主要是作用于少数几种病原体，而对宿主则影响较少或没有影响，这就叫做药物的选择性。药物作用的选择性是相对的，多数药物可对好几个器官或组织发生作用，没有一个药物只产生单一的作用。例如，洋地黄在治疗剂量时能选择性地作用于心肌，主要是加强心肌的收缩力，但在大剂量时也可使血管收缩。属于化疗药的抗微生物药，在适当剂量时选择性地抑制微生物的生长繁殖而不影响人体的功能，但也可出现不良反应。抗肿瘤药更是如此。它们虽然选择性地干扰肿瘤细胞的代谢，抑制其增殖，但由于机体细胞的代谢过程在某些方面与肿瘤细胞的代谢过程有些相似，因而也能抑制人体骨髓细胞的造血功能引起白细胞减少或出现其它一系列不良反应，如胃肠道扰乱等。

至于一般原生质毒则是对任何细胞的原生质均有一定的毒性作用，可说是没有什么选择性。

药物作用选择性规律的重要性主要有：

- (1) 以它为根据可将成百上千的药物分成各种不同的类别；
- (2) 可为临床药物治疗提供选择药物的依据，做到对症下药。

关于选择性作用，产生的方式或机理问题还不完全清楚，它显然与药物的化学结构有关，而受体学说有可能给予部分说明。这将在有关章节中讨论。

二、药物作用的两重性（防治作用与不良反应）

药物在发生防治作用的同时，也往往引起一些不利的影响甚至是毒性反应，这是药物作用两重性的表现。

（一）药物的防治作用

1. 预防作用 是指事先用药防止疾病或症状发生的作用。一般的预防性注射或在疟疾流行地区定期服用乙胺嘧啶以迅速控制流行，这些都是预防作用的例子。

2. 治疗作用 分为对因治疗与对症治疗两个方面，前者是指用以消除病因的疗法而后者则是用以缓解症状的疗法。抗微生物、抗寄生虫病药是对因治疗的类型，它们能抑制或杀灭致病病原体。而镇痛药、祛痰药与止喘药等则属于对症治疗的类型，它们可使症状获得改善，但不能消除病因。一般讲，对因治疗比对症治疗重要。但在某些情况下，对症治疗的重要性并不亚于对因治疗。例如剧烈的疼痛往往能引起休克，镇痛药虽不能解除引起疼痛的原因，但由于疼痛的缓解可避免休克的发生，因此对防止休克的发生也可说是对因治疗。同样，止喘药虽不能消除引起哮喘的原因，但由于支气管痉挛的缓解，可避免因哮喘反复发作而引起的严重并发症，对这些并发症来说也起到了对因治疗的作用。所以对因治疗与对症治疗的区分也不是绝对的。

（二）药物的不良反应 这是对病人不利的反应，是药物的副作用、毒性反应、过敏反应和继发反应等的总称，应该尽量避免。

1. 副作用 指在常用量时所发生的与治疗无关的不良反应。如麻黄碱在止喘的同时能兴奋中枢神经系统，引起失眠。止喘是它的治疗作用，而引起失眠则是它的副作用。又如阿托品在缓解胃肠道平滑肌痉挛的同时能引起口干、视觉模糊，于是解痉是它的治疗作用，其它就成了它的副作用。在不同的情况下，由于用药的目的性不同，所谓副作用也可以用于治疗。例如在全身麻醉时，为了减少呼吸道的分泌、防止窒息，往往要利用阿托品减少分泌的作用，此时其减少分泌的作用成了治疗作用而松弛平滑肌，导致腹胀的作用就成了副作用。为了防止副作用，往往可采用合并用药的方法，例如避免麻黄碱引起的失眠，可同时服用安眠药。

2. 毒性反应 是指用药剂量过大或时间过长而发生的不良反应。这类反应在性质上和程度上都与副作用不同，对病人的危害性也较大，反应所涉及的系统可因所用药物不同而有所差异，但概括起来主要有以下几个方面：

（1）神经系统的损害 如氨基糖甙类抗菌素、链霉素、卡那霉素、庆大霉素及新霉素等能引起耳蜗前庭器官的损害，导致平衡失调、听觉减退或丧失。

（2）消化器官的损害 胃肠道反应在药物反应中占重要地位，发生率相当高，如口服