

药 理 学

(试 用 讲 义)

北 京 中 医 学 院

1 9 7 4 年 1 月

目

录

第 一 章 总论	(1)
第一节 药物的作用	(1)
一、药物作用的基本形式—兴奋和抑制	(2)
二、药物作用的选择性	(2)
三、药物的作用部位	(2)
四、治疗作用和不良反应	(3)
第二节 影响药物作用的因素	(3)
一、药物因素	(4)
二、机体因素	(5)
三、给药途径	(7)
四、药物的体内过程	(7)
第 二 章 麻醉药	(9)
第一节 全身麻醉药	(9)
一、全身麻醉的分期	(9)
二、常用的全身麻醉药	(11)
三、复合麻醉	(12)
第二节 局部麻醉药	(12)
第 三 章 镇静、催眠药, 抗癫痫药和抗惊厥药	(14)
一、镇静、催眠药	(14)
二、抗癫痫药	(18)
三、抗惊厥药	(19)
第 四 章 安定药	(21)
第 五 章 镇痛药	(24)
一、阿片类镇痛药	(24)
二、人工合成镇痛药	(26)
第 六 章 解热镇痛药	(29)
一、水杨酸类	(29)
二、吡唑酮类	(30)
三、苯胺类	(31)
四、其他	(33)
五、有解热镇痛作用的中草药	(33)
第 七 章 中枢兴奋药	(34)
第 八 章 作用于传出神经末梢部分的药物	(37)

第一节 概说.....	(37)
一、传出神经的解剖生理.....	(37)
二、传出神经的化学传递.....	(39)
三、介质的代谢.....	(41)
四、传出神经药物的分类.....	(42)
第二节 拟胆碱药.....	(43)
一、节后拟胆碱药.....	(43)
二、胆碱酯酶抑制药.....	(44)
第三节 抗胆碱药.....	(46)
一、节后抗胆碱药.....	(46)
二、神经节阻断药.....	(49)
三、骨骼肌松弛药.....	(49)
第四节 拟肾上腺素药.....	(50)
第五节 抗肾上腺素药与抗肾上腺素能神经药.....	(54)
一、抗肾上腺素药.....	(54)
二、抗肾上腺素能神经药.....	(54)
第九章 作用于心脏的药物.....	(55)
第一节 强心甙.....	(55)
第二节 抗心律失常药.....	(60)
第三节 抗心绞痛药.....	(62)
附：降低血清脂类的药物.....	(64)
第十章 降压药.....	(65)
一、抗肾上腺素能神经药.....	(65)
二、神经节阻断药.....	(68)
三、血管平滑肌松弛药.....	(69)
四、利尿降压药.....	(69)
五、具有降压作用的中草药.....	(70)
第十一章 作用于消化系统的药物.....	(70)
第一节 助消化药.....	(70)
第二节 抗酸药.....	(72)
第三节 泻药与止泻药.....	(74)
第四节 肝病辅助用药.....	(75)
第十二章 作用于呼吸系统的药物.....	(77)
一、镇咳药.....	(77)
二、祛痰药.....	(78)
三、平喘药.....	(80)
第十三章 利尿药与脱水剂.....	(80)
第一节 利尿药.....	(80)
第二节 脱水剂.....	(84)
第三节 具有利尿消肿作用的中草药.....	(84)

第十四章 子宫收缩药	(85)
第十五章 作用于血与造血系统的药物	(87)
第一节 止血药	(87)
一、主要促进凝血过程的药物	(87)
二、主要影响血管因素的药物	(89)
三、止血中草药	(89)
第二节 治疗贫血的药物	(90)
第十六章 抗过敏药	(91)
一、抗组织胺药	(92)
二、钙盐	(93)
第十七章 激素制剂	(93)
第一节 肾上腺皮质激素与促皮质激素	(93)
一、肾上腺皮质激素	(93)
二、促皮质激素	(97)
三、甘草	(98)
第二节 甲状腺及抗甲状腺药	(98)
一、甲状腺制剂	(98)
二、抗甲状腺药物	(98)
第三节 治疗糖尿病药物	(101)
一、胰岛素	(101)
二、口服降血糖药	(102)
第四节 性激素与避孕药	(103)
一、雌激素	(103)
二、孕激素	(104)
三、雄激素	(105)
四、避孕药	(105)
第十八章 磺胺类与呋喃类药物	(106)
第一节 磺胺类及磺胺增效剂	(106)
一、磺胺类	(106)
二、磺胺增效剂	(110)
第二节 呋喃类药物	(112)
第十九章 抗菌素	(112)
第一节 青霉素类	(113)
第二节 链霉素类	(116)
第三节 氯霉素与合霉素	(118)
第四节 四环素类	(119)
第五节 其他抗菌素	(121)
第六节 有关抗菌素临床应用中的几个问题	(122)
第七节 抗菌中草药	(123)
第二十章 抗结核药	(126)

一、常用抗结核药.....	(126)
二、其他抗结核药.....	(128)
第二十一章 抗寄生虫药.....	(128)
第一节 驱肠虫药.....	(128)
一、主要用于驱蛔虫、蛲虫的药物.....	(129)
二、主要用于驱钩虫的药物.....	(130)
三、主要用于驱绦虫的药物.....	(130)
第二节 抗疟药.....	(131)
一、主要控制症状的药物.....	(131)
二、控制复发与传播的药物.....	(133)
三、主要用于预防的药物.....	(134)
第三节 抗阿米巴病药.....	(134)
第四节 抗滴虫病药.....	(136)
第五节 抗血吸虫病药.....	(136)
第六节 抗血丝虫病药.....	(137)
第二十二章 抗恶性肿瘤药.....	(138)
一、细胞毒类.....	(138)
二、抗代谢类.....	(140)
三、抗菌素类.....	(141)
四、激素类.....	(142)
五、中草药类.....	(143)
第二十三章 中毒与解救.....	(144)
第一节 金属与类金属毒物的解毒剂.....	(144)
第二节 有机磷酸酯类中毒的解毒剂.....	(145)
第三节 氰化物中毒及其解毒剂.....	(146)

第一章 总论

药物及药物知识的来源:

药物是我们用以预防和治疗疾病的物质,是人类用来和疾病做斗争的重要武器。有关药物的知识是人民群众在长期的生产斗争和科学实践中,逐渐积累和发展起来的。因此药物科学和其他科学一样,是人民群众智慧的结晶,是劳动人民所创造的。

祖国医药学是我国劳动人民长期同疾病做斗争的极为丰富的经验总结。几千年来对我国民族的繁衍昌盛,起了重大的作用。我国医学中有关药物科学的著作,如公元前一、二世纪的神农本草经,唐代的新修本草,宋朝的太平惠民和局方,尤其是明代李时珍编写的本草纲目等书籍,不仅是祖国医学宝库中的重要组成部分,也是世界药物文献中最早的重要著作。它们对世界药物科学作出了极为重大的贡献,也为发展现代药理学提供了宝贵的资料。

目前应用的药物,依其来源可分为两大类,除天然的植物、动物、矿物药外,随着生产力的提高和现代科学技术的发展,还有大量利用生物学方法和化学合成方法大规模生产的人工合成药物。

药理学的研究对象和任务:

十九世纪以来,由于化学、生理学、生物化学、微生物学等现代自然科学的发展,人们开始采用这些近代科学的实验方法来研究药物对机体的作用,于是产生了药理学。药理学是研究药物与机体相互作用及其规律的一门科学,它的主要研究对象是药物对机体产生的作用,药物在体内发生的变化(体内过程),影响药物作用的因素以及这些作用、变化发生的规律和原理(机制)。从而阐明药物防治疾病的道理。

学习药理学的首要任务,就是要在毛主席光辉哲学思想指导之下,运用辩证唯物主义的观点、方法学习药物的作用及其原理、影响药物作用的各种因素等知识,为临床上正确运用药物治疗打下必要的理论基础。同时应对药物、机体、病原体三者之间的相互关系能有正确的理解。一定要牢记毛主席“辩证唯物法认为外因是变化的条件,内因是变化的根据,外因通过内因而起作用。”的教导,要坚决克服那种片面强调药物作用,过份迷信特效药的见药不见人的错误倾向,在应用药物的过程中注意充份发挥人的主观能动作用,调动和增强人体内部的抗病能力,以战胜疾病。

毛主席教导我们“中国医药学是一个伟大的宝库,应当努力发掘,加以提高。”我国各地都有着丰富的药材资源,运用现代药理学的知识和方法,进一步整理发掘中草药,研究中草药的药理作用及其在防治疾病中的原理、规律,促进中西医结合,为创立中国新医药学而奋斗,也是药理学的一个艰巨而光荣的任务。

现在有不少疾病尚缺少满意的防治药物,因此药理学尚负有与其他学科紧密配合,进行现有药物的改造和寻找新药的任务。

第一节 药物的作用

药物的作用是指药物对人体和病原体所产生的影响。药物进入机体后,主要是通过对其

体内部原有功能活动的影响而起作用的。故药物的作用就是机体在药物影响下所发生的功能活动的改变。药物只能改变机体原有的功能，而不能产生新的功能。

一、药物作用的基本形式—兴奋和抑制

药物作用虽然表现有多种多样，但归纳起来基本上不外是兴奋和抑制两个方面。凡能使机体功能活动增强的称为**兴奋作用**。如肾上腺素使心跳增快，增强，尼可刹米使被抑制的呼吸中枢兴奋等。反之能使机体功能活动减弱的称为**抑制作用**，如阿托品使腺体分泌减少、使胃肠平滑肌松弛，心得安使心跳减慢、减弱等。药物就是通过这种兴奋或抑制作用，以促使机体失调的功能恢复，从而达到治疗疾病的目的。

药物的兴奋作用和抑制作用按其程度的不同又可分为以下几种情况：将机体功能从正常以下提高至正常称强壮作用；将机体功能提高到正常水平以上称兴奋作用。将机体过高的功能降低到正常称镇静作用；将机体功能降低到正常以下称抑制作用；过度抑制以致功能活动几乎近于停止状态时称为麻痹。

兴奋作用和抑制作用，不是绝对孤立的，在一定的条件下可以互相转化，如呼吸兴奋药对延脑生命中枢有兴奋作用，但如剂量过大，则会使此等中枢由于过度兴奋转为衰竭，而产生相反的效果。

二、药物作用的选择性

药物对机体各组织器官的作用并不完全一样。当药物与机体组织接触时，常常对某些组织器官发生明显的作用，而对其他组织器官的影响很小或几乎不发生作用。例如洋地黄主要对心脏有明显影响，麦角对子宫作用特别显著，抗菌药物主要对病原体有明显作用而对人体影响较小等。这种情况称为**药物作用的选择性**，或称**药物的选择作用**。选择作用发生的基础，现在认为，药物对于机体组织器官的作用，是药物参与或干涉该组织生理生化过程而引起的。机体不同的组织细胞，不仅形态不同，而且生理生化过程也各有特点，这种特点就成为具有不同理化性状、结构特点的药物产生选择作用的物质基础。

现在临床应用的各种药物，所以能够分成不同的类别，就是根据各种药物具有不同的选择作用的缘故。一般说来，药物作用的选择性越高，它在治疗应用时的针对性就越强，副作用则相应较少。因此阐明或设法提高药物的选择性作用，不仅对临床用药有指导意义，并且是改进药物和寻找新药的一个方向。

药物的选择作用也是相对的，随着剂量的改变，选择性也会发生变化，如剂量增大，很多药物常会对其原来没有影响的组织器官，发生作用。

三、药物的作用部位

局部作用和吸收作用：局部作用是药物未吸收入血以前，在用药局部出现的作用，如局部麻醉药在注射部位出现的局部麻醉作用，抗酸药在胃内中和胃酸的作用等都是局部作用。当药物吸收进入血液循环分布于全身以后，所表现的作用称吸收作用。如双氢克尿塞吸收后，作用于肾脏产生的利尿作用，肾上腺素进入体内引起的强心作用，皆为吸收作用。治疗

上如果需要局部作用，就应设法使药物停留在局部。如果要利用吸收作用，就应使药物尽量吸收。因此需适当选择给药途径和剂型，以便使药物发挥最大的疗效。

直接作用与间接作用：在药物接触的组织器官上引起的原发作用称直接作用。由于直接作用的结果，而在其他组织器官上所呈现的作用称间接作用。例如洋地黄治疗心力衰竭时，从用药部位吸收后，直接作用于心脏，加强心肌收缩力，这是直接作用，由于心脏功能的恢复和血液循环的改善，使肾血流增加而呈现的利尿消肿作用，就是间接作用。间接作用由于药物作用于内、外感受器，通过神经反射途径而实现者，称为**反射作用**。如昏倒时吸入氨水，刺激呼吸道粘膜，反射地兴奋呼吸中枢。即为反射作用。

四、治疗作用和不良反应

“我们必须学会全面地看问题，不但要看到事物的正面，也要看到它的反面。”事物都是一分为二的，药物对机体产生的作用有有利的一面，也有其不利的一面。在临床治疗上希望发生的有利作用，叫作治疗作用。与治疗目的无关而不利于机体的一切作用统称**不良反应**。用药时应很好的考虑这两方面的情况以便充分发挥药物的治疗作用，尽量减少或避免不良反应。治疗作用与不良反应是相对的，随着治疗需要的不同而改变。如阿托品有松弛平滑肌和抑制腺体分泌的作用，在用其解除平滑肌痉挛性疼痛时，后者所致的口干属不良反应。当用阿托品作麻醉前给药时，抑制腺体分泌的作用可对抗乙醚引起的腺体分泌增加，则成为治疗作用。

治疗作用：可分为对因治疗和对症治疗两种。对因治疗的目的在于消除引起疾病的原因。如感染性疾病时应用抗菌药物，维生素缺乏时补充维生素等。对症治疗的目的在于解除或减轻疾病的各种症状，并防止由此而引起的进一步病变。如剧痛可致休克，及时使用镇痛药，可以缓解疼痛而防止休克发生。故对症治疗和对因治疗在临床医疗实践中都是必要的，可根据病情选择或配合应用。

不良反应：可分为：

(一) **副作用：**药物在治疗量时所产生的与治疗目的无关的作用，如麻黄碱在解除支气管哮喘时引起的失眠、心悸，阿托品治疗溃疡病时出现的口干、视力模糊等皆为副作用。副作用一般表现较轻，大多是可以耐受的，但当病人的有关组织或器官的功能原来就不健全时，药物的副作用有时也能引起严重后果。故某种疾病时需慎用或禁用某种药物，此称为“**禁忌症**”。例如青光眼就是阿托品的禁忌症。

(二) **毒性反应：**一般是用药量过大或用药时间过久，所产生的较严重的不良反应。如长期应用链霉素后，对第八对脑神经的损害，过量洋地黄引起的心律失常等。

(三) **过敏反应：**只有特异质的病人才会发生，与用药剂量无关，即使极小量，也可发生极其严重的反应，如青霉素引起的过敏性休克。药物过敏反应可能是通过抗原—抗体反应而引起的。

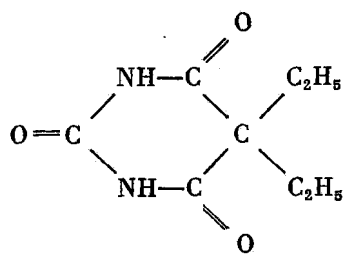
第二节 影响药物作用的因素

药物的作用是药物与机体相互作用的综合表现，药物与机体双方的各种因素，都可对药

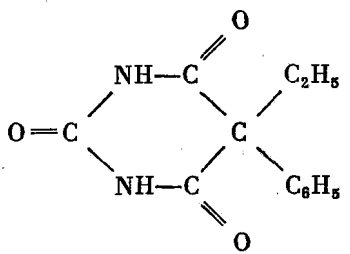
物的作用产生影响。因此在应用药物防治疾病的过程中，掌握影响药物作用的各种因素和条件，对正确用药是必须的。

一、药物因素

药物的化学结构：由于药物化学结构的不同，所以各种药物有不同的性状和作用，化学结构类似的药物往往具有相似的药理作用。如巴比妥、苯巴比妥等巴比妥类催眠药，主要结构相似，故有类似的中枢抑制作用。

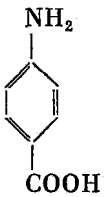


巴 比 妥

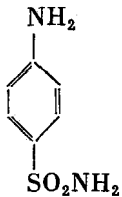


苯巴比妥

但是也有相反的情况，化学结构相似的药物，有时也可表现出拮抗作用（相反的作用），一般称竞争性对抗。如对氨基甲酸是某些细菌所需的营养物质，磺胺类药物由于化学结构与其相似，因而与之产生竞争，使细菌得不到营养物质而受到抑制。



对氨基甲酸



氨苯磺胺

药物的化学结构与药理作用之间关系的阐明是合成新药的一重要基础。

药物的剂量：药物的剂量和作用之间有密切的关系。“任何质量都表现为一定的数量，没有数量也就没有质量。”在一定范围内，随着剂量的增加药物作用的强度也相应增强。但当剂量超过一定限度时，则会发生质的变化，可以由治疗作用转化而为毒性反应。所以在用药过程中一定要注意决定质量的数量界限，慎重选用剂量。

当进入机体的药物剂量极小时，可完全不表现作用。开始出现治疗作用的最小剂量，称最小有效量。比最小有效量大，对机体产生明显治疗作用而又不引起毒性反应的剂量，称治疗量或常用量。治疗量的最大限度称极量，极量是治疗作用和中毒作用的分界点。超过极量通常是不安全的。较极量稍大引起中毒的最低剂量称最小中毒量。严重中毒引起死亡的剂量，称致死量。

药物的最小有效量和最小中毒量之间的距离，称安全范围，也称治疗宽度。药物的安全范围越大，越安全。对于安全范围小的药物，应用时要特别警惕毒性反应的发生。

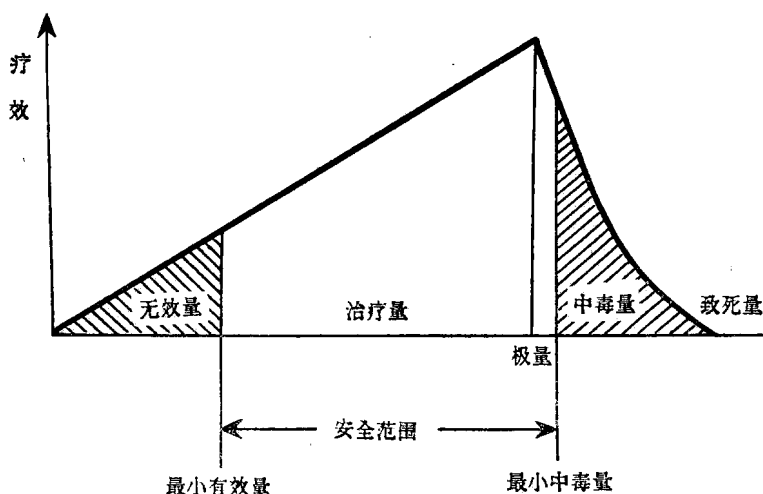


图 1—1 药物剂量与疗效的关系

儿童用药剂量：小儿体重较轻，药物剂量须按体重计算酌减，从成人剂量计算儿童剂量的公式如下：

$$\text{儿童剂量} = \text{成人剂量} \times \frac{\text{儿童体重 (市斤)}}{120}$$

为了节省称量体重的手续，通常儿童体重多根据年龄作粗略折算。折算公式为：

$$1 \text{ 岁以下 体重 (公斤)} = \text{月龄} \div 2 + 3$$

$$1 \text{ 岁以上 体重 (公斤)} = \text{年龄} \times 2 + 7。$$

有些药物在书籍中直接记载按每公斤体重应用的剂量，如氯丙嗪的小儿剂量为 0.5—1.0 mg/公斤/次，即可按儿童体重直接计算用量。

生物检定：有些药物不能用物理或化学的方法检定质量，需用生物实验的方法测定其有效量或致死量，并和标准品比较以检定其效价这种方法称为生物检定。例如垂体后叶素，胰岛素等都需进行生物检定，这些药的效价和用量就以“单位”表示。由国际协议规定的单位称为“国际单位”。

配伍用药：当两种或两种以上药物同时应用时，可能互相影响而改变药物的作用。合并用药的结果使作用增强者称协同作用，互相拮抗而作用减弱者称拮抗作用。利用前者可以增强疗效，如巴比妥类催眠药能增强解热镇痛药的作用。拮抗作用多应用于药物中毒的解救和纠正药物的付作用。如有机磷农药中毒时的许多症状可用阿托品对抗。苯巴比妥与麻黄碱合并应用，可纠正后者引起失眠之付作用。至于药物伍用时，引起某种物理、化学变化，如沉淀，变质等则称为配伍禁忌，处方时应极力避免。

二、机 体 因 素

年龄和性别：儿童除因体重与成人不同外，还因其神经系统或代谢过程等方面的生理特点（如药物代谢酶系统尚未完善）故对药物的反应与成人常有不同。例如，儿童对催眠药、强心甙、阿托品类、磺胺类等药物的耐受性常较成人大，而新生儿对吗啡则特别敏感，即使

按体重计算用量，也易引起中毒。因此，在用药过程中应充份注意到儿童对药物反应的这些差异性。

性别方面需注意妇女的特殊生理情况，如在月经期，妊娠期不宜服用剧烈泻药，以免引起月经过多，早产或流产。此外还应考虑药物是否可通过胎盘或乳腺，对胎儿和乳儿产生影响。

个体差异：在年龄性别体重等条件相似的情况下，不同个体对药物的反应仍可出现差别，此即个体差异，个体差异主要表现在量的方面，偶也可发生质的不同。

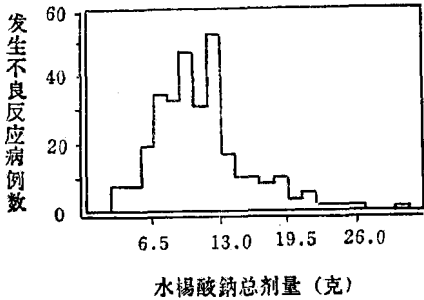


图 1—2 病人发生水杨酸钠不良反应的个体差异

在 300 个男病人应用水杨酸钠治疗中，约有 2/3 病人在总剂量 6.5—13.0 间发生不良反应。但在 3.25 时已有少数人出现反应，而个别病人则在总量达到 30.0 左右才有反应，剂量相差几达 10 倍。

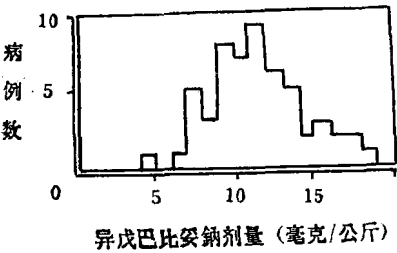


图 1—3 异戊巴比妥钠有效剂量的个体差异

于 55 个产妇，用异戊巴比妥钠缓慢静脉注射来产生麻醉。大部分产妇在 10 毫克/公斤左右的剂量时可以产生麻醉，但个别人在 5 毫克/公斤时已麻醉，而另外有人到 19 毫克/公斤时才被麻醉。

(一) 高敏性：指个体对药物的作用特别敏感，应用很小剂量即能产生强烈作用或毒性反应，而对于大多数人只有应用很大剂量，才会产生同样的反应。

(二) 耐受性：和高敏性相反，是指个体对药物的敏感性较小，需用较大剂量，甚至用一般个体中毒的剂量，才能发生治疗作用。耐受性多数是后天反复用药形成的。如失眠患者长期服用巴比妥类催眠药，其催眠作用常会逐渐减弱，最后必须增加剂量，才能重新出现疗效。这就是个体对药物产生了耐受性的缘故。后天耐受性在停用药物后，可逐渐消退。因此临床应用某些药时，要避免过久地连续使用，以免产生耐受性而降低疗效。

在产生耐受性后，一旦停药，病人有继续应用药物的欲望，称为**习惯性**。若停药后不仅有继续用药的欲望，而且有严重的戒断症状出现时，称为**成瘾**。吗啡、度冷丁等就是能产生成瘾性的药物，须严加控制和管理。

病原体对药物产生的耐受性，称**耐药性**或**抗药性**。抗药性形成后，该药疗效即行降低或完全失效，往往需换用其他药物进行治疗。

(三) 特异质：指个体体质特殊，对于药物的反应与多数人有质的不同。例如青霉素对某些人在很小量时就引起皮疹、哮喘甚至危险的过敏性休克，而一般人即使应用大剂量也不会发生类似的反应。这种特殊体质称为**特异质**，这种反应称**特异质反应**。原因还不完全明了。而变态反应(或称过敏反应)为此类反应中较多见之形式。较易引起过敏反应的常用药物有青霉素、链霉素、巴比妥类、氨基比林、以及含蛋白的制剂等。有些复方成药中含有容易

引起过敏的成分（如撒烈痛片中含巴比妥类），对此也应有所了解。

病理状态：许多药物的作用也受机体病理状态的影响。有些药物只对失调的机体功能有影响。如解热药只降低发烧病人的体温，而对正常人的体温一般无影响。强心甙只对衰竭心脏作用明显，对正常心脏通常并不表现强心作用。

肝、肾功能不良时，由于药物在体内的解毒、排泄发生障碍，容易引起中毒，故有些药物应减量、慎用或禁用。

三、给 药 途 径

给药途径不同，可以影响药物吸收的量和吸收的速度，也能影响药物在体内的分布，故不仅决定药物作用的快、慢、强、弱、有时也可影响药物作用的性质。

口服给药：简单、安全，是最常用的给药途径。但胃肠道对药物的吸收缓慢，且不够规则，一般需经15—30分钟才能发挥作用，所以对危急、昏迷等病人不适用。有些药物易被酸、硷或消化酶所破坏，如肾上腺素、胰岛素、青霉素G等，则不应口服给药。有的药如硫酸镁等在胃肠道内极难吸收，口服时只表现局部作用（泻下、利胆）如需发挥吸收作用（降压，抗惊厥等）则不宜口服。

注射给药：常用的有皮下注射、肌肉注射、静脉注射、静脉滴注等方法。静注时药物直接入血，作用最快，剂量准确，适用于急救。但作用维持时间较短，为了要长期维持血中有效浓度，可用静滴方法给药，静滴还允许输入较大量的药物或液体。但静注制剂必须是纯净、透明的水性溶液。油溶液、混悬液绝不能静注。皮下或肌注时，一般几分钟到十几分钟开始发生作用。肌注时吸收较快、疼痛较少。油剂或混悬剂可肌注。刺激性强的药物，一般都不可皮下或肌注，以免引起局部炎症或坏死。

此外，为了增加药物局部浓度，提高疗效还有椎管内注射，腔内注射、动脉内注射等。小剂量药物穴位注射，有用量小，疗效好，副作用小的特点，是中西医结合的新生事物，应进一步总结提高。

舌下或直肠给药：为避免胃肠道破坏及肝脏代谢的影响或减少对胃的刺激作用，有些药物可舌下含服，经口腔粘膜吸收如硝酸甘油。少数药物亦可经直肠给药，如水合氯醛可灌肠给予。

吸入给药：呼吸道粘膜及肺泡可迅速吸收药物，挥发性药物如亚硝酸异戊酯、乙醚等主要经此途径给药。此外如异丙肾肾上腺素喷雾剂等，亦可喷雾吸入给药。除能迅速发挥作用外，且可减少不良反应的发生。

四、药物的体内过程

进入体内的药物，不仅可以作用于机体改变机体的功能，同时在机体的作用下，药物本身也将发生一系列的变化。包括药物在体内场所（空间位置）的变更和药物结构的变化。前者指药物的吸收、分布、排泄、后者称药物的代谢（亦称结构转化）。药物的体内过程是这两种变化—吸收，分布、代谢，排泄的总称。在这种相互作用中，药物的体内过程反过来又影响着药物的作用。

吸收：药物从给药部位进入血液循环的过程称吸收。药物被机体吸收的快慢、难易受多

方面因素影响。吸收面的组织特性为一重要因素。在正常情况下，吸收由难到易、由慢到快的次序为：皮肤、粘膜、胃肠道、皮下、肌肉、肺泡。当吸收面发炎或血流速度改变时，可改变吸收速度。如胃肠道淤血时，药物吸收就会大大减少。此外，药物的理化性状亦为一重要影响因素。在吸收面上既不溶于水也不溶于脂肪的药物，很难吸收。例如水溶性的氯化钡易吸收而呈剧烈毒性，在水及脂肪中皆不溶解的硫酸钡，则可大量吞服作胃肠造影而不致吸收引起钡中毒。一些解离度高，脂溶性低的药物，如季胺盐类（六烃季胺等）在肠内也难吸收。

内服药物主要在小肠吸收，其吸收机制有下述两种：

（一）简单扩散：生物膜（细胞膜或多细胞形成的膜以及亚细胞结构的膜之通称）上含有一层类脂质，并有一些贯穿过膜的微细孔道。脂溶性物质，可以溶于生物膜的类脂质中，经过简单扩散，自高浓度向低浓度方向通过生物膜。脂溶性愈大，则扩散愈易，由于药物的分子解离成离子时脂溶性很小，所以药物的解离度愈小，脂溶性就愈大，就愈容易通过胃肠道的生物膜而吸收。例如在肠 pH 下，链霉素和磺胺脒几乎完全解离，因而很少吸收。小分子的水溶性物质则可经膜上的微细孔道而通过生物膜。此种简单扩散不需消耗能量。

（二）特殊转运过程（主动转运）：脂溶性小而分子量很大的药物以及离子态的药物。可由低浓度一侧向高浓度一侧逆向转运，这是因为生物膜中有特殊的转运机构。被运转的物质，在细胞膜的一侧先与载体结合成复合物，此种复合物通过某种耗能的机制，转运到膜的另一侧。卸下被运转物，载体再回到原位与新的被运转物结合，往返载运以进行吸收。此外，特殊运转亦可通过转运酶，促进被转运物质变为脂溶性或水溶性小分子，以便经过简单扩散达到膜之另一侧。

除吸收外，药物在体内通过其他组织生物膜之方式，亦与此相同，如通过血脑屏障、肾小管上皮细胞等。

分布：药物吸收入血液循环后，在各组织中的分布是不相同的。药物在组织中分布的特点主要受下列因素影响：

（一）药物与血浆蛋白结合的能力：药物与血浆蛋白结合后，不易通过生物膜。故与血浆蛋白结合率愈高，则停留在血液内的量愈多，时间也愈长。而分布到蛋白含量低的体液（如脑脊液）中的药物也愈少。如磺胺嘧啶的血浆蛋白结合率低，在脑脊液中的浓度也就较高。此为其选用于治疗流行性脑脊髓膜炎的主要原因。

（二）药物通过细胞膜之能力：脂溶性高的药物容易通过生物膜，因而大都分布在细胞内，也易透过血脑屏障而进入脑脊液。季胺盐类物质如六烃季胺、箭毒等脂溶性低，即使静注也难进入中枢神经系统。许多无机离子如 Na^+ 、 Cl^- 等，脂溶性很低，主要分布在细胞外体液中。

（三）对组织的特殊亲和力：有些药物对某些组织有特殊的亲和力，而表现出特殊的组织分布。例如碘在甲状腺中的浓度较其他组织高一万倍。汞、镉等重金属在肝、肾中沉积较多，药物集中的组织、有时有利于治疗，但中毒时也容易造成损害。药物对组织器官的选择性作用，不一定与药物在该器官的分布相平行，如强心甙分布于肝脏较多，分布于心肌较少，但却是具有高度选择作用的强心药。

代谢：大多数药物都要在体内经过不同程度的结构转化，这就是药物的代谢。代谢的方式，主要有氧化、还原、分解、结合。药物代谢的结果，大都使其作用减弱或消失。此过程亦称解毒。肝脏是药物代谢的主要器官，故肝功能不良时，可影响机体解毒功能，使药物毒性增加。但也有少数药物在体内不经变化而以原形排出。也有个别药物经过代谢后，反而增强疗效或毒性。如氯胍本身无效，在体内转变为环氯胍后，才发生抗疟作用。

排泄：药物在体内经过一定时间后，最终将以原形或其代谢产物排出体外。肾脏是药物

排泄的主要器官。此外，气体或挥发性液体，可通过呼吸道排出。有些药物也可有小量经消化道，唾液腺，乳腺排出。对乳儿健康有影响的药物，在授乳期用药时应注意。

从肾脏排出药物，主要通过肾小球滤出，但与血浆蛋白结合的药物不能滤出，因而不易排出。有些药物也可由肾小管上皮细胞分泌出来（如青霉素）。进入原尿中的药物，部分地又可由肾小管被重吸收回血液。重吸收的快慢多少，对药物的排泄有直接影响。如脂溶性高解离度低的药物，易通过生物膜，而较易再吸收，这样由尿排泄就慢。弱酸或弱碱性药物的排泄，尚可受尿液 pH 的影响。如水杨酸盐（弱酸）不宜并用碳酸氢钠，就是因为后者使尿碱化，弱酸类物质在碱性环境中解离度高，重吸收少，可增加水杨酸钠的排泄，因而会减弱水杨酸类的疗效。

在药物排泄所经的器官中，药物的浓度都较高。有些药物如仍保持药理作用时，则可利用以治疗这些器官的疾病，如呋喃坦丁主要经肾排泄，尿内浓度高，故主要用于抗尿路感染。但同时也应警惕在这些器官中出现毒性反应，如汞经肾及消化道粘膜排出时，易损伤局部组织。

药物排泄速度的快慢，决定药物在体内停留时间的长短。排泄快的必须反复多次给药，才能维持体内有效浓度。排泄慢的则给药间隔可较长。肾功能不良一般易发生药物的蓄积中毒，用药时应注意。

第二章 麻 醉 药

第一节 全 身 麻 醉 药

全身麻醉是指应用药物使中枢神经系统的某些机能暂停，表现出病人意识、感觉和多种反射活动消失，骨骼肌松弛，但延髓主要生命中枢的机能仍然存在，维持着呼吸和心血管活动的一种综合表现。其目的为解除病人手术时的痛苦，便于外科手术顺利进行。

祖国医学早在1700多年前，就开始用麻沸汤使病人麻醉，施行手术。这是世界上最早使用的全身麻醉药。解放后，尤其在无产阶级文化大革命后，我国广大医务工作者遵照伟大领袖毛主席“中国医药学是一个伟大的宝库，应当努力发掘，加以提高。”的教导，不断实践，不断总结提高，使中药麻醉重放光彩。采用以洋金花为主的中草药用口服或肌肉注射的方法进行全身麻醉，已取得一定的临床效果。虽然目前尚存在一些麻醉深度不易控制及肌肉松弛不够理想等一些问题，但中药麻醉这一新生事物，在无产阶级革命路线指引下和广大医务人员的努力下，一定能逐步地完善起来。

一、全身麻醉的分期

全身麻醉药主要通过抑制中枢神经系统而产生麻醉作用。此类药物对中枢神经系统的抑制作用有一定的顺序，首先抑制大脑皮质，随着血中浓度的增加抑制范围逐渐扩展到皮质下中枢、中脑、脊髓，最后可抑制延髓。为了判断和掌握麻醉的深浅，便于调节给药速度，根据麻醉时中枢神经系统各部位被抑制所表现的各种体征，人为地将麻醉过程分为四期。

现以乙醚为例，说明麻醉分期如下：

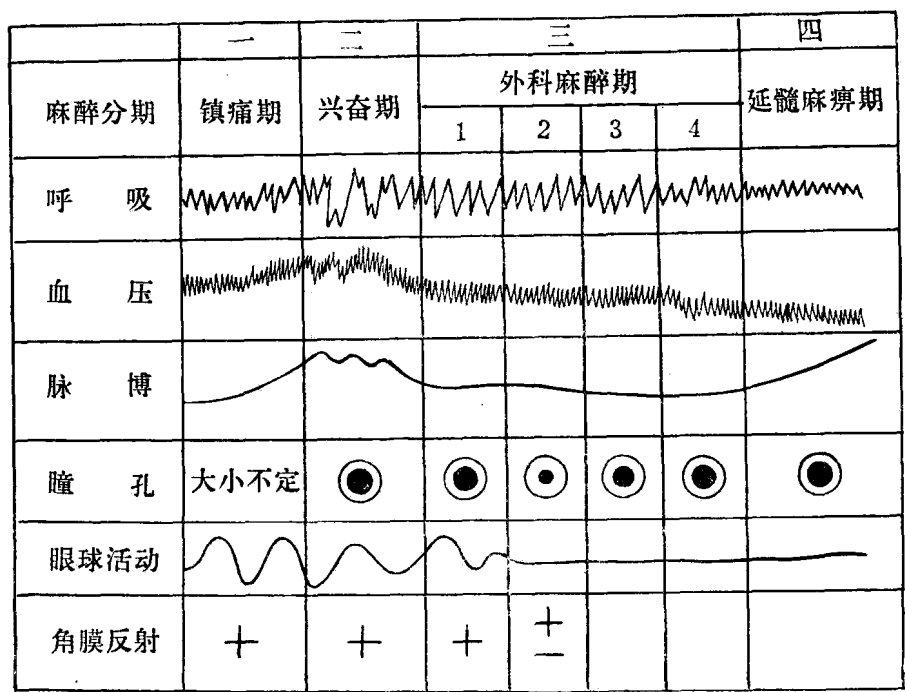


图 2—1 全身麻醉的分期

第一期 镇痛期—从给药开始到意识完全消失为止。此期大脑皮层的高级功能受到抑制，病人意识逐渐模糊，感觉迟钝，然后逐渐消失。在感觉中痛觉先消失，触觉次之，听觉最后。此期中脉搏略快，血压稍升。

第二期 兴奋期—此期大脑皮层受到较深的抑制，皮层下中枢脱离控制，因而患者失去意识和自制能力，出现谵妄、叫喊、挣扎等兴奋现象。同时心率加快、血压上升、眼球转动、瞳孔扩大、呼吸极不规则。但全部反射活动仍然存在，可引起咳嗽、呕吐等现象。由于呼吸忽快忽慢或暂停，易使病人一次吸入过量麻醉药，突然提高血中浓度，引起心律失常或麻醉延髓，危及生命。故兴奋期对病人有较大的危险性，须设法避免或尽快渡过。

第一期和第二期又合称为**诱导期**。

第三期 外科麻醉期—此期皮层下中枢和脊髓渐次被抑制，但延髓生命中枢仍健全，患者主要表现为兴奋中止、安静、肌肉松弛、反射活动减弱或消失，呼吸规则，血压、心率平稳，瞳孔大小正常。临床上又将此期细分为四级（详见麻醉分期图）。一般手术都可在此期的第一，第二级进行。麻醉时应适当调节给药速度及剂量，使麻醉维持在外科手术期的第一、二级以利于手术进行。

麻醉终止时，患者即以相反的顺序通过各期而恢复。恢复后常呈较长时期的睡眠状态。

第四期 延髓麻痹期—如果麻醉不当，在第三期继续加深麻醉，使延髓生命中枢受到抑制，便进入此期，又称**中毒期**。患者呼吸停止，血压降至休克水平，最后心跳停止而死亡。此期在临床麻醉时绝对不允许产生。一旦发现麻醉过深，应立即停药并进行人工呼吸和抢救。

二、常用的全身麻醉药

乙 醚 Aether

性状：为无色透明液体，有刺激性臭味，易挥发（沸点35℃），具燃烧性及爆炸性，故禁忌接近开放性火焰。

作用和应用：乙醚为目前临床应用最广的全身麻醉药。以吸入法给药，经肺吸收后引起全身麻醉。除应用于手术麻醉外，对急剧惊厥亦可使用乙醚吸入进行解救。乙醚的优点为：

（一）麻醉效果确实，横纹肌松弛完全。

（二）安全范围大，全身麻醉所需浓度（4%）与呼吸麻痹的浓度（11%）相差较远，故不易引起麻醉过量。

（三）对心、肝、肾毒性小。

（四）吸收和排泄皆迅速，麻醉深浅度容易控制和调节。

不良反应及应用注意：

（一）乙醚具有较大的局部刺激作用，易引起呼吸道粘膜分泌增加，造成呼吸道阻塞或麻醉后肺炎并发症的发生。

（二）诱导期较长，兴奋现象明显，如掌握不好易出现麻醉意外。

制剂：

麻醉醚 Aether pro [Narcosi]：是经过检查不含杂质的乙醚，每瓶 150 ml 或 250 ml。开瓶置于空气中 2—3 小时后不可再用，因乙醚在光和空气作用下可产生毒性大的乙醛及过氧化物。

氟 烷 Halothane (Fluothane)

性状：为澄明液体无刺激性，不燃烧也不爆炸，沸点50—51℃。性较稳定。

作用：与乙醚相比优点为：

（一）麻醉力强，诱导期短。吸入 1—3% 蒸汽，一般可迅速（3—5 分钟）到达外科麻醉期。恢复也较迅速。

（二）刺激性小。

不良反应：

（一）对心血管和呼吸的抑制作用较强，可引起血压下降，心率减慢。氟烷能使心肌对肾上腺素类药物敏感性增高，如麻醉过深时可能诱发心律失常。

（二）对肝脏有一定毒性，肝功能不全病人禁用。

（三）抑制子宫收缩，易致产后出血，故不用于产科手术。

制剂：

氟烷：每瓶 20ml, 250ml, 不宜曝光，因可使毒性增加。

硫喷妥钠 Thiopentalum Natrium

作用及应用：硫喷妥钠为超短时作用的巴比妥类药物。临床上用做静脉麻醉。特点是作

用迅速，诱导期短，无兴奋现象。一次静脉注射给药麻醉作用维持时间短暂，约为20—30分钟。一般根据手术需要，反复静注或静滴以维持麻醉。其缺点为麻醉深度不易操纵，痛觉消失不够完全，骨骼肌松弛不够满意，有时可发生喉痉挛，抑制呼吸作用较明显。

本药主要在肝中代谢，肝病患者应慎用。

临床用于静脉麻醉，诱导麻醉和基础麻醉。也可用于抗惊厥。

制剂：

硫喷妥钠注射剂：每支0.5，1.0。为浅黄色粉末有吸湿性，其水溶液不稳定。临用时配成1.25—2.5%溶液，静注。

三、复合麻醉

为了增加麻醉强度和安全性，减少药物的不良反应，常将几种麻醉药或与其他药物互相配合同时伍用，此称为复合麻醉。

(一) 诱导麻醉：为了避免乙醚等药冗长的诱导期，利用麻醉作用强的药物如硫喷妥钠使病人迅速通过诱导期，然后用乙醚维持。

(二) 基础麻醉：即用麻醉药物引起浅麻醉，在此基础上再用其他药物麻醉。主要用于不能合作的病人和小儿。

(三) 麻醉前给药：在麻醉前应用药物，以纠正麻醉药之缺点，增强麻醉强度，如乙醚麻醉前用阿托品类药物对抗其引起的腺体分泌增加作用。也可应用巴比妥类药物，氯丙嗪等，使病人处于镇静状态，并可增强麻醉作用和减少麻醉药用量。

(四) 骨骼肌松弛剂：常用箭毒或琥珀酰胆碱等使肌肉松弛，可在较浅的麻醉下便于手术操作，从而减少麻醉药用量，增加安全性。

第二节 局部麻醉药

局部麻醉药能选择性地麻醉周围神经末梢和神经纤维，使神经冲动传导暂时阻断，而引起局部麻醉。在麻醉浓度下对组织无刺激，无损伤，麻醉后神经组织可完全恢复其原有功能。由于局部麻醉药作用迅速，毒性小，麻醉深度和持续时间能满足外科手术的需要，故目前临床应用广泛。

局部麻醉方式：

(一) 表面麻醉：将药物滴于粘膜表面，使粘膜下的感觉神经末梢麻醉。用于口腔、鼻、喉、眼及泌尿科等手术，应用的药物应对粘膜有较强的穿透力。

(二) 浸润麻醉：将药物注射到皮下或深部组织中，使该部的神经纤维或末梢麻醉。

(三) 传导麻醉：将药物注射于神经干周围，使该神经干所支配的区域发生麻醉。又称神经干阻滞。

(四) 脊椎麻醉：将药物注入脊髓蛛网膜下腔，麻醉脊神经根。因多自腰椎间给药，故亦称腰麻。主要用以麻醉盆腔及下肢。

(五) 硬膜外麻醉：将药物注入椎管硬脊膜外间隙，以麻醉脊神经根。由于药液不易扩散，对血压及呼吸影响较小，比腰麻安全。