

军医大学军医专业基本教材

# 药 理 学

第三军医大学主编

中國醫藥大學藥劑學系編

# 藥 理 學

第二版 人民衛生出版社

军医大学军医专业基本教材

# 药 理 学

主 编

林 兆 僊

编 者

左 箴	朱清平	刘菊芳	沈企华	李英衢
李锐松	林兆僊	姚丹帆	姜 涓	赵德化
唐汝愚	顾科民	陶静仪	盛宝恒	黄钺华
谢发祥	董桂林	谭世杰	谭建权	廖锡麟

参 加 汇 审 者

朱清平	刘菊芳	李英衢	林兆僊	姚丹帆
唐汝愚	黄钺华	谢发祥	谭世杰	

# 目 录

<b>第一篇 药理学总论</b> .....	1
<b>第一章 药物的来源和制剂</b> .....	1
一、药物的来源 .....	1
二、植物药的有效成分 .....	1
三、药物的制剂 .....	2
四、药典 .....	2
<b>第二章 药理学的基本规律</b> .....	3
<b>第一节 药物的作用</b> .....	3
一、药物作用的基本类型 .....	3
二、药物作用的选择性 .....	4
三、药物作用的原理 .....	4
<b>第二节 影响药物作用的因素</b> .....	5
一、机体方面的因素 .....	5
二、药物方面的因素 .....	6
三、用药方法方面的因素 .....	7
<b>第三节 药物的体内过程</b> .....	8
一、生物膜与药物转运 .....	8
二、吸收 .....	9
三、分布和储存 .....	9
四、生物转化 .....	10
五、排泄 .....	10
六、药物在体内过程中的相互作用 .....	10
七、药物的体内过程在指导用药中的意义 .....	11
<b>第三章 处方学</b> .....	11
一、处方的意义 .....	11
二、处方的基本结构 .....	11
三、处方的基本类型 .....	12
四、书写处方的一般规则及注意事项 .....	13
五、常用处方举例 .....	13
<b>第二篇 作用于中枢神经系统的药物</b> .....	14
<b>第四章 镇静催眠药</b> .....	14
<b>第一节 巴比妥类</b> .....	14
<b>第二节 其它镇静催眠药</b> .....	18
<b>第五章 抗癫痫药</b> .....	21
<b>第六章 安定药</b> .....	25
一、吩噻嗪类 .....	25

二、丁酰苯类·····	30
三、硫杂蒽类·····	31
〔附〕 治疗震颤麻痹的药物·····	32
<b>第七章 镇痛药</b> ·····	<b>34</b>
一、阿片硷类镇痛药·····	34
二、合成镇痛药·····	37
三、具有镇痛作用的中草药——延胡索·····	39
<b>第八章 解热镇痛药</b> ·····	<b>41</b>
概述·····	41
一、水杨酸类·····	42
二、苯胺类·····	44
三、吡唑酮类·····	45
四、新型消炎镇痛药·····	46
五、解热镇痛药的复方制剂·····	47
六、中草药·····	48
<b>第九章 麻醉药</b> ·····	<b>50</b>
第一节 全身麻醉药·····	50
一、全身麻醉药的定义·····	50
二、全身麻醉药的作用原理·····	50
三、全身麻醉的临床分期·····	51
四、常用的全身麻醉药·····	52
五、中药麻醉·····	56
六、麻醉综合用药·····	57
第二节 局部麻醉药·····	57
<b>第十章 中枢兴奋药</b> ·····	<b>63</b>
〔附〕 抗忧郁药·····	66
<b>第三篇 作用于传出神经末梢区域的药物</b> ·····	<b>68</b>
概论·····	68
一、传出神经系统在解剖学上的分类·····	68
二、传出神经系统按递质的分类·····	69
三、传出神经系统的受体·····	70
四、传出神经系统的生理功能·····	71
五、传出神经系统药物作用的基本原理·····	73
六、传出神经系统药物的分类·····	74
<b>第十一章 拟胆硷药</b> ·····	<b>75</b>
第一节 作用于胆硷受体的拟胆硷药·····	76
第二节 抗胆硷酯酶药·····	78
<b>第十二章 抗胆硷药</b> ·····	<b>83</b>
第一节 M胆硷受体阻断药·····	83

第二节	N胆碱受体阻断药	88
一、	神经节阻断药	88
二、	骨骼肌松弛药	88
<b>第十三章</b>	有机磷酸酯类中毒与解救	91
一、	有机磷酸酯类	91
二、	有机磷酸酯类的解毒药	93
<b>第十四章</b>	拟肾上腺素药与抗肾上腺素药	96
第一节	拟肾上腺素药	98
一、	作用于 $\alpha$ 和 $\beta$ 受体的拟肾上腺素药	98
二、	主要作用于 $\alpha$ 受体的拟肾上腺素药	101
三、	主要作用于 $\beta$ 受体的拟肾上腺素药	102
第二节	抗肾上腺素药	105
一、	$\alpha$ 受体阻断药	105
二、	$\beta$ 受体阻断药	106
〔附〕	血管收缩药及扩张药在休克治疗中的应用	108
<b>第四篇</b>	<b>影响内脏器官功能的药物</b>	<b>110</b>
<b>第十五章</b>	祛痰药、止咳药与平喘药	110
概述		110
第一节	祛痰药	111
一、	恶心性祛痰药	111
二、	刺激性祛痰药	111
三、	溶解性祛痰药	112
四、	祛痰中草药	113
第二节	镇咳药	113
一、	中枢性镇咳药	113
二、	末梢性镇咳药	115
第三节	平喘药	115
一、	肾上腺素 $\beta$ 受体兴奋药	117
二、	茶碱类	118
三、	肾上腺皮质激素	119
四、	色甘酸二钠	119
五、	平喘中草药	119
<b>第十六章</b>	作用于消化系统的药物	122
第一节	助消化药	122
第二节	治疗消化性溃疡的药物	123
一、	抗酸药	123
二、	解痉药	125
三、	组织胺 $H_2$ 受体阻断药	125
四、	促进溃疡面愈合的药物	125

第三节	泻药 .....	126
一、	容积性泻药 .....	126
二、	刺激性泻药 .....	126
三、	润滑性泻药 .....	127
四、	泻药的选择应用和应用注意事项 .....	127
第四节	止泻药 .....	128
第五节	治疗肝脏疾病的辅助药 .....	129
一、	增强肝脏功能、促进肝细胞再生的药物 .....	129
二、	抗脂肪肝药物 .....	130
三、	防治肝昏迷的药物 .....	131
四、	治疗肝炎的中草药 .....	132
第六节	利胆药 .....	133
<b>第十七章</b>	<b>强心甙 .....</b>	<b>136</b>
<b>第十八章</b>	<b>抗心律失常药 .....</b>	<b>146</b>
第一节	心肌电生理学的基本概念与药物作用的原理 .....	146
第二节	抗心律失常药 .....	150
<b>第十九章</b>	<b>抗心绞痛药与降血脂药 .....</b>	<b>159</b>
第一节	抗心绞痛药 .....	159
一、	硝酸酯与亚硝酸酯类 .....	160
二、	$\beta$ 受体阻断药 .....	162
三、	其他抗心绞痛药 .....	163
四、	中草药 .....	164
第二节	降血脂药 .....	166
一、	主要降低甘油三酯的药物 .....	166
二、	主要降低胆固醇的药物 .....	167
三、	其它 .....	168
<b>第二十章</b>	<b>抗高血压药 .....</b>	<b>171</b>
第一节	交感神经抑制药 .....	172
一、	外周交感神经抑制药 .....	172
二、	神经节阻断药 .....	174
三、	中枢性降压药 .....	175
四、	$\beta$ 受体阻断药 .....	176
第二节	血管扩张药 .....	177
第三节	利尿降压药 .....	179
第四节	降压中草药 .....	180
第五节	抗高血压药的选择应用 .....	180
<b>第二十一章</b>	<b>利尿药及脱水药 .....</b>	<b>184</b>
第一节	利尿药 .....	184
一、	泌尿的生理与药物利尿的作用方式 .....	184

二、常用利尿药 .....	186
三、利尿药的选择应用 .....	194
第二节 脱水药 .....	195
<b>第二十二章 子宫收缩药 .....</b>	<b>197</b>
<b>第五篇 激素、维生素及影响血液与造血系统的药物 .....</b>	<b>204</b>
<b>第二十三章 肾上腺皮质激素类药物 .....</b>	<b>204</b>
<b>第二十四章 抗过敏及抗晕动药 .....</b>	<b>215</b>
第一节 抗组胺药 .....	215
第二节 作用于效应器官和抑制介质释放的药物 .....	219
第三节 钙盐 .....	219
第四节 抗晕动药 .....	220
<b>第二十五章 甲状腺激素与抗甲状腺药 .....</b>	<b>222</b>
第一节 甲状腺激素 .....	222
第二节 抗甲状腺药 .....	225
<b>第二十六章 治疗糖尿病的药物 .....</b>	<b>230</b>
第一节 胰岛素 .....	230
第二节 口服降血糖药 .....	233
<b>第二十七章 性激素与避孕药 .....</b>	<b>236</b>
第一节 雄激素与同化激素 .....	237
第二节 雌激素与孕激素 .....	239
第三节 避孕药 .....	242
<b>第二十八章 维生素类药物 .....</b>	<b>247</b>
一、水溶性维生素类 .....	247
二、脂溶性维生素类 .....	250
<b>第二十九章 影响造血系统的药物 .....</b>	<b>253</b>
第一节 治贫血药 .....	253
第二节 促白细胞增生的药物 .....	258
<b>第三十章 止血药与抗凝血药 .....</b>	<b>260</b>
第一节 止血药 .....	260
一、影响凝血过程的药物 .....	261
二、抗纤维蛋白溶解的药物 .....	264
三、主要作用于血管的药物 .....	264
第二节 抗凝血药 .....	265
一、抗凝血药 .....	265
二、抗血小板粘聚的药物 .....	269
三、血栓溶解药 .....	270
<b>第六篇 抗病原体与抗恶性肿瘤的药物 .....</b>	<b>273</b>
<b>第三十一章 磺胺类、抗菌增效剂与呋喃类药物 .....</b>	<b>273</b>
第一节 磺胺类药物与抗菌增效剂 .....	273

第二节 呋喃类药物 .....	283
<b>第三十二章 抗菌素类 .....</b>	<b>286</b>
第一节 主要用于革兰氏阳性细菌感染的抗菌素 .....	288
一、青霉素类 .....	288
二、先锋霉素类 .....	294
三、红霉素 .....	296
四、其他 .....	296
第二节 主要用于革兰氏阴性细菌感染的抗菌素 .....	297
一、氨基甙类 .....	297
二、多粘菌素类 .....	301
三、创新霉素 .....	301
第三节 广谱抗菌素 .....	301
一、四环素类 .....	301
二、氯霉素与合霉素 .....	304
第四节 抗真菌抗菌素 .....	307
第五节 抗感染中草药 .....	308
第六节 抗菌素药物的应用原则 .....	309
一、严格掌握适应症, 合理选药 .....	309
二、避免细菌抗药性的产生 .....	310
三、肝、肾功能与抗菌素使用的关系 .....	310
四、抗菌素的联合应用 .....	311
〔附〕 抗病毒药物 .....	316
<b>第三十三章 抗结核病药 .....</b>	<b>317</b>
<b>第三十四章 抗疟药 .....</b>	<b>322</b>
一、主要用于控制症状的抗疟药 .....	323
二、主要用于防止复发和传播的抗疟药 .....	326
三、主要用于病因性预防的抗疟药 .....	327
四、磺胺类、砒类及甲氧苄氨嘧啶 .....	328
五、抗疟药的选择应用 .....	329
<b>第三十五章 抗阿米巴病药 .....</b>	<b>330</b>
一、对肠内外阿米巴病均有疗效的药物 .....	330
二、主要用于肠内阿米巴病的药物 .....	332
三、主要用于肠外阿米巴病的药物 .....	334
<b>第三十六章 抗血吸虫病药和抗血丝虫病药 .....</b>	<b>336</b>
第一节 抗血吸虫病药 .....	336
第二节 抗丝虫病药 .....	341
<b>第三十七章 驱肠虫药 .....</b>	<b>344</b>
一、主要用于驱蛔虫的药物 .....	344
二、主要用于驱钩虫的药物 .....	345

三、主要用于驱蛲虫的药物 .....	346
四、主要用于驱绦虫的药物 .....	347
五、驱肠虫药的选择应用及常规注意事项 .....	347
<b>第三十八章 消毒防腐药</b> .....	349
<b>第三十九章 抗恶性肿瘤药（附免疫抑制剂）</b> .....	358
第一节 烷化剂类 .....	359
一、氮芥类烷化剂 .....	359
二、非氮芥类烷化剂 .....	361
第二节 抗代谢物类 .....	363
一、抗嘧啶类 .....	363
二、抗嘌呤类 .....	365
三、抗叶酸类 .....	365
第三节 抗菌素类 .....	366
第四节 植物药类 .....	367
第五节 激素类 .....	368
第六节 其它抗癌药 .....	369
第七节 联合用药与序贯疗法 .....	370
〔附〕 免疫抑制剂 .....	372
英文药名索引 .....	374

# 第一篇 药理学总论

## 概 述

药理学是研究药物防治疾病的基础理论。学习药理学是为了掌握药物防治疾病的基本规律，为学习临床医学和军事医学奠定必要的药理学理论基础。在理论基础方面，要求掌握总论中重要的基本概念；掌握各论中代表性药物的主要防治作用和应用，重要的不良反应及其防治，对指导用药有意义的体内过程，理解较肯定的作用原理；对各论中的一般药物，则掌握其作用与应用的特点；对其他内容作一般了解。

药理学的发展始于药物学，早在二千年前我国就出版了《神农本草经》，总结了汉代以前所积累的药物学知识，是我国最早的药物学著作。到了明朝，李时珍在总结前人经验的基础上，通过实地考察，写成《本草纲目》，全书 190 万字，1892 种药物，一万多个药方，是一部内容丰富的药物学巨著，促进了祖国医药学的发展，对世界医药学的发展也有很大贡献。

我国在解放前的较长时期中，由于三座大山的压迫，祖国医药学受到歧视和摧残，药理学的发展也受到了阻碍。自从解放以后，我国医药学的发展才有了广阔的前景，广大的医药卫生人员遵照毛主席关于“中国医药学是一个伟大的宝库，应当努力发掘，加以提高”的指示，在积极为工农兵防治疾病的工作中，对许多中草药进行了大量的临床和实验药理学研究，如对防治气管炎、心血管疾病、肿瘤、感染性疾病的中草药和中药麻醉、抗胆碱中草药等的研究，都取得了显著成就；对于抗菌素、化学合成药等的研究，也取得很大进展。但是，由于林彪和“四人帮”的干扰和破坏，使我国的医药学和其他工作一样，未能得到应有的发展。粉碎“四人帮”以后，医药卫生事业又重新蓬勃发展起来，尤其是党的十一届三中全会以来，医药卫生人员更加斗志昂扬，决心为创造我国统一的新医药学而努力奋斗，为在本世纪内实现我国的社会主义现代化作出应有的贡献。

## 第一章 药物的来源和制剂

一、药物的来源 药物有两种来源，一是天然产物，包括来自植物、动物或矿物的药品；一是人工制造，包括化学合成品（如阿司匹林）和半合成品（如新青霉素Ⅱ等）。

二、植物药的有效成分 植物是重要的药物来源之一，尤其在祖国医药学中，植物药更有重要地位。提纯中草药的有效成分，去粗取精，将促进中西医结合。植物药的有效成分很多，最重要的有以下几类。

（一）生物碱 很多植物药的有效成分是生物碱，它们是一类含氮的有机碱，可与酸结合成盐类。游离的生物碱难溶于水而易溶于有机溶剂，生物碱的盐类则易溶于水，故临床上多用其盐类。

(二)甙类 是由糖和非糖化合物缩合而成，其分子中的非糖部分称为甙元，是决定甙类药物作用的基本结构，而糖则是甙类分子中有亲水性的部分，可增加甙类的水溶性。

(三)黄酮类 此类化合物的数目很多，药理作用也较广泛，其中大多数黄酮对心血管系统有明显作用，有的黄酮则有较好的抗菌作用，加以黄酮类广泛地存在于植物药中，故近年来很受重视。

(四)皂甙类 是甙的特殊形式，它们的水溶液在振荡时可产生泡沫，故称皂甙。

(五)其他 如有机酸、油类和中性成分等。

三、药物的制剂 是药物经过加工制作，成为便于保存与使用，而其有效成分基本不变的制品。通常将药物的制剂分为以下三大类型：

#### (一)液体剂型

1. 溶液剂 多为不挥发药的水溶液。

2. 注射剂 是药物的灭菌溶液或混悬液，供注射用，注射剂常封装在安瓿中，故又称安瓿剂。在溶液中不稳定的药物则以干燥粉末封装，临用前制成溶液。

3. 合剂 是由多种药物配合制成的透明或混浊的水性溶液，但有的合剂，如棕色合剂，早已改成片剂，便于临床应用。

4. 煎剂 是水煎煮后的生药煎出液，是中草药常用的制剂之一。

5. 糖浆剂 是含药的蔗糖浓溶液。

6. 酊剂 一般指生药的酒精性浸出液，但习惯上把某些化学药品的酒精溶液也称为酊剂，如碘酊。

#### (二)软性剂型

1. 软膏 是用油脂或其他半固体作基质，加药品并研匀制成的半固体外用制剂。

2. 栓剂 是用它塞入身体各种腔道的软性制剂。其基质的熔点接近体温，在室温下为固态，塞入腔道后就能逐渐熔化而发挥作用。

#### (三)固体剂型

1. 片剂 是药粉加赋形剂后经压制而成的小圆片。便于携带、分发和服用，是最常用的制剂。

2. 散剂 是内用或外用的干燥、均匀的粉状药物。容易潮解的药物不宜做成散剂。

3. 胶囊剂 是把药物装在胶囊内以便吞服的制剂。有一种胶囊可以完整地经过胃而到肠内，在肠内的碱性环境才破裂以发挥药效，称为肠溶胶囊。

四、药典 药典是国家关于药品生产、供应、使用和管理的法定文件。我国在公元659年颁发的《唐新本草》是世界上第一部药典。1930年国民党反动政府颁发了一部《中华药典》，内容几乎全部是从资本主义国家硬搬过来的，编成后将近20年未加修改。中华人民共和国成立后，人民政府对人民健康十分关心，不久就颁发了《中华人民共和国药典》1953年版，以后又根据情况的发展，出版了药典的增补本和新版本。我国新版药典的编写是在整理提高祖国医药学、吸收国内外先进经验和充分利用我国资源的基础上进行的，刊载了常用而有效的中西药品和制剂，规定药品规格的国家标准，对每种药品载明其性状、鉴别、检验方法，扼要说明其作用和用途，规定常用量和毒剧药的极量等，这在提高药品质量和保障人民健康方面起了巨大作用。

(第三军医大学 黄钺华)

## 第二章 药理学的基本规律

药理学的基本规律是指导合理用药的基本规律，学习这些规律必须以辩证唯物主义为指导，才能深刻理解，灵活掌握。这些规律包括药物的作用和影响药物作用的因素。

### 第一节 药物的作用

#### 一、药物作用的基本类型

药物的作用多种多样，但主要有以下几对基本作用类型。

(一)防治作用和不良反应 从用药的目的和效果来分析，有防治作用和不良反应。

1. 防治作用 是对防治疾病有利的作用，包括预防作用(可预防疾病)和治疗作用(可治疗疾病)。“预防为主”是我国卫生工作的重要方针之一，应充分重视药物的预防作用。此外，药物的治疗作用往往也有重要的预防意义。例如积极治疗慢性气管炎和高血压等疾病，就有利于预防这些疾病的并发症。又如积极治疗传染性疾病的病人和带菌者，就有利于控制传染的来源，这是预防传染病的重要环节之一。

2. 不良反应 所谓不良反应实际上包括了药物的不良作用和机体的不利反应。例如付作用、毒性作用和过敏反应。

(1)付作用 是指药物在防治剂量下产生的与防治目的无关的作用。这种多余的作用一般较轻微，但也可能使病人不适或痛苦。例如肾上腺素用于哮喘时，除有缓解哮喘的防治作用外，还有兴奋心脏引起心悸的付作用。付作用是可预料到的，必要时可用其他药物或措施加以纠正。付作用和防治作用在不同的用药目的下可以互相转化，例如上述举例中的肾上腺素用于心跳骤停时，它兴奋心脏的作用就转化为治疗作用了。

(2)毒性作用 比付作用严重，可引起机体发生严重的功能紊乱，甚至发生组织的病理变化。毒性作用常因药物用量过大或用药时间过久而产生。控制药量和用药时间是减少毒性作用的重要措施。必要时应停药或改用其它药物。

(3)过敏反应 某些药物的常用量甚至微量就可能引起过敏反应，这种反应只见于少数具有过敏体质的个体，过敏反应是有免疫机制参予的变态反应，是前一次接触药物致敏后，再次用药时所出现的反应。预防对药物的过敏反应，可以通过询问病史，对有过敏病史的病人应慎用易致过敏的药物。对于危险性较大的药物(如青霉素)，用药前要作过敏试验，阳性反应者应禁用这种药物。

由于应用药物的目的是要利用药物的作用来防治疾病。药物有防治作用，但又会引起不良反应，这是贯穿整个药理学中的基本矛盾。要充分发挥药物的防治作用而避免不良反应，就要解决好这对矛盾。要解决矛盾，首先要分析矛盾，下面的几对基本作用类型和药物作用的选择性、药物作用的原理主要都是用来分析这对矛盾双方的特点。

(二)兴奋作用和抑制作用 从药物作用于机体的基本性质来分析，有兴奋作用和抑制作用。增强机体某种功能的作用叫兴奋作用，减弱某种功能叫抑制作用。由于疾病(如甲状腺

功能亢进)或药物(如麻黄碱)引起的不良反应使机体某种功能兴奋时(如中枢兴奋而烦躁不安),可用对此种功能有抑制作用的药物(如镇静催眠药)来防治。反之,某种功能抑制时,可用对此有兴奋作用的药物来防治。

(三)局部作用和吸收作用 根据药物发挥作用的部位和范围来分析,有局部作用和吸收作用。药物未经吸收而在用药的部位起作用叫局部作用,药物在吸收入血液循环后发挥作用叫吸收作用。吸收作用可引起机体多数系统的功能改变时称整体的作用。局部作用主要发生在局部,但也可通过反射等过程而产生整体的作用。局部和整体是辩证统一的。若药物的局部作用是防治作用,则其吸收作用可能引起不良反应(如普鲁卡因作局部浸润麻醉时,吸收过多就可能引起惊厥等不良反应),故应防止药物吸收,才能充分发挥其防治作用而避免不良反应。反之,若吸收作用是药物的防治作用,就要使吸收速度适应病情需要,并防止局部作用引起的不良反应。

(四)直接作用和间接作用 从药物发生作用的顺序来分析,有直接作用和间接作用。例如强心甙对心肌的兴奋作用是直接作用(或原发性作用),是治疗心力衰竭病人的治疗作用,它可以改善心衰病人的血液循环而出现利尿作用,故利尿就是它的间接作用(或继发性作用)。分析间接作用和直接作用,就可以透过现象看到本质而合理用药,不会滥用强心甙作为一般的利尿药。

二、药物作用的选择性 药物在常用量下一般只对某个器官或组织产生最明显的作用,这就是药物作用的选择性,这种选择性是由于药物和某种组织细胞有较大的亲和力。药物作用的选择性不但是药物分类的基础,而且掌握药物作用的选择性,将使用药的针对性加强,可以较好地发挥其防治作用而减少不良反应。但药物作用的选择性是相对的,随着药物用量的增加,药物作用的范围将会扩大,就可产生不良反应,故还必须掌握药物的用量。

三、药物作用的原理 药物作用的原理就是药物为什么发生防治作用和引起不良反应的道理。阐明作用的原理将使选药用药更有明确的理论基础,同时也为寻找新药提供重要的理论依据,目前对很多药物的作用原理认识还很不够,随着科学技术的不断发展,对它的认识将逐步深入。

药物(外因)是通过机体(内因)而起作用,因此要从药物和机体两方面来分析药物作用的原理。

(一)从药物方面分析 主要是药物的化学结构与作用的关系,除少数药物是由物理性能发挥作用外,大多数药物是通过化学性能而发挥作用的。药物的化学结构必须和机体某种组织细胞的生化特性相适应,才能干扰或参与机体内的生化过程而发挥作用,所以药物的化学结构与其作用有密切关系。化学结构相似的药物往往产生类似的药理作用,但也可能产生相反的作用(对抗或阻断)。参看下面受体学说中的阻断剂和激动剂。

(二)从机体方面分析 主要有以下的作用原理。

1. 受体学说 这个学说已在不少药物的研究中被阐明,受体学说认为,大多数药物要和效应细胞的受体结合后才能起作用,大多数受体是细胞膜上的特殊蛋白质(少数药物,如类固醇激素的受体则在胞浆),由于受体蛋白质的外表部分有其生化和结构的特点,化学结构与此特点相适应的药物就和受体有特异性亲和力,因此能和受体结合,结合后药物还要有内在活性(即药物引起机体反应的能力或称效应力)才能产生作用。对受体有亲和力又有内在活性的药物称兴奋剂或激动剂,只对受体有亲和力而无内在活性的药物称对抗药或阻断剂。阻断剂和受体结合后,非但不能激动受体,而且因它占据了受体而阻碍激动剂发挥作

用。例如去甲肾上腺素对肾上腺素 $\alpha$ -受体有较大亲和力，又有较大内在活性，故为一种激动剂。苯苄胺只对此类受体有亲和力而无内在活性，因此能阻断去甲肾上腺素与此类受体结合，是一种阻断剂。

2. 酶促和酶抑 有的药物是通过促进机体某种酶的活性而发挥作用的称酶促作用，如胰岛素通过促进己糖激酶的活性起作用等。通过抑制某种酶的活性而发挥作用则称酶抑作用，如新斯的明通过抑制胆碱酯酶的活性而发挥作用等。

3. 改变细胞膜的通透性 细胞膜通过主动转运的功能来维持正常的细胞内外渗透压及离子分布。药物改变细胞膜的通透性将改变细胞的功能而发挥药理作用，例如局部麻醉药就是由于使给药局部的神经细胞膜通透性发生改变，结果阻碍钠离子进入细胞膜，不能产生去极化，阻滞了神经冲动的传导而产生局部麻醉作用。

药物对机体的这些作用原理，往往互相联系，现在已知某些药物的作用涉及上述三种作用原理。例如强心甙作用于心肌细胞膜上的受体，这种受体就是 $\text{Na}^+ - \text{K}^+ \text{ATP}$ 酶，这种酶和强心甙结合后，酶的活性受抑制，结果使心肌细胞膜对 $\text{Na}^+$ 、 $\text{K}^+$ 、 $\text{Ca}^{2+}$ 的通透性发生改变，由此产生独特的强心作用。

## 第二节 影响药物作用的因素

前面提到防治作用和不良反应是贯穿整个药理学中的基本矛盾，为了解决好这个矛盾，先从不同的角度分析了矛盾双方的特点。但是矛盾着的双方必有一方是矛盾的主要方面，他方是次要方面。矛盾的主要方面和次要方面可以在一定条件下互相转化，因此还必须掌握矛盾转化的条件，以便创造条件，促使防治作用向矛盾的主要方面转化，而不良作用向次要方面转化。所谓矛盾转化的条件，在药理学中就是影响药物作用的因素，这些因素主要有以下几个方面。

### 一、机体方面的因素

(一)人的主观能动性 药物是我们同疾病作斗争的重要武器，但是，片面强调药物作用的“唯药物论”是错误的。所以，在应用药物防治疾病时，除应重视药物的作用外，还必须充分发挥医务人员和伤病员的主观能动性，以革命的精神，积极地同疾病作斗争，才能最大限度地发挥药物的防治作用。

(二)疾病的特点 药物是外因，是条件，机体是内因，是根据，在运用药物防治疾病时，必须按照机体疾病发生发展的规律，有的放矢地用药。此外，病理状态能改变机体的功能和药物的反应，因此能影响药物的作用。例如，一般用量的解热药，并不降低正常人的体温，但对发热的病人则可解热。又如肝、肾功能减退时，可显著延长或加强许多药物的作用，甚至引起中毒，必须特别注意。

(三)体重、性别和年龄 体重小者一般应酌减药量，体重大者应酌增药量。性别不同者对性激素和作用于性器官的药物有明显不同的反应。此外，妇女在月经和妊娠期中，对泻药和许多刺激性强烈的药物较敏感，可使盆腔器官反射性充血，子宫收缩加强，有引起月经过多、甚至流产、早产等不良反应的危险。在孕妇和授乳妇女，还应考虑药物可能通过胎盘和乳汁而对胎儿或婴儿发生的影响。

一般成人(18—60岁)对药物的反应没有年龄上的明显差别，但60岁以上的老年人对药

物的代谢和排泄功能减弱，故应比一般成人的药量减少1/4。此外，老年人对肾上腺素和麻醉药等比较敏感。儿童对药物的反应也与一般成人不同，主要因体重不同有关，故儿童尤其是幼儿常按体重计算药量。但除体重以外，儿童的神经系统、内分泌系统和各脏器的发育尚不完善，而代谢又比较旺盛，用药时应与成人有所区别。幼婴和新生儿对吗啡特别敏感，按体重计算药量也易中毒，故当禁用。

(四)个体差异 即使体重、性别、年龄和所用药量都相同，不同的个体对药物的反应仍可出现差异，这就是个体差异，其主要表现有以下几方面。

1. 耐受性 指机体对药物的反应性比一般人低得多，用一般药量不能见效。耐受性又有先天的和后天的两种，先天的耐受性多与遗传有关，后天耐受性则因反复用药后，机体的反应性逐渐减弱。机体产生后天耐受性的原理尚未充分了解，现知机体对某些药物的耐受性是因肝细胞微粒体中药酶合成增多，使这些药物在体内的代谢加速而致作用减退。此外，对某些药物的耐受性则主要是由于机体的反应细胞出现适应能力所致。凡能使机体产生耐受性的药物，应避免长期使用，必要时可间歇用药或与其他药物交替应用。

2. 高敏性 指机体对药物的作用很敏感，用很小的药量就能产生强大的作用甚至中毒。

3. 特异质 由遗传因素引起的、对药物反应性质特殊的差异称特异质，现知许多特异质反应是遗传性生化缺陷病，是因缺乏某些酶而引起。

二、药物方面的因素 在影响药物作用的因素中，药物方面的因素除了药物的化学结构（见第二章药物作用的原理）和药物的制剂（见第一章）以外，还有药物的剂量和药物作用的相互影响。

### (一)药物的剂量

1. 药物的剂量与作用的关系（参看图2-1）这种关系是指随着药物的剂量不断地增加，其药理作用也不断相应增强的规律性变化。能引起药理作用的最小剂量叫做最小有效量。剂量增加则作用相应加强，当剂量增到一定程度时，量变引起质变，产生中毒作用，这个剂量称中毒量。最低的中毒量称最小中毒量。严重中毒以致引起死亡的剂量称致死量。治疗量（或称常用量）是防治疾病时通常采用的剂量，比最小有效量高而比极量低。极量是指安全用药的剂量极限，超过极量就可能发生中毒。然而必须注意剂量的相对性，规定的治疗量和极量虽然适用于大多数人，但有少数人对药物的敏感性可能差异很大，必须根据个体反应的差异调整剂量。

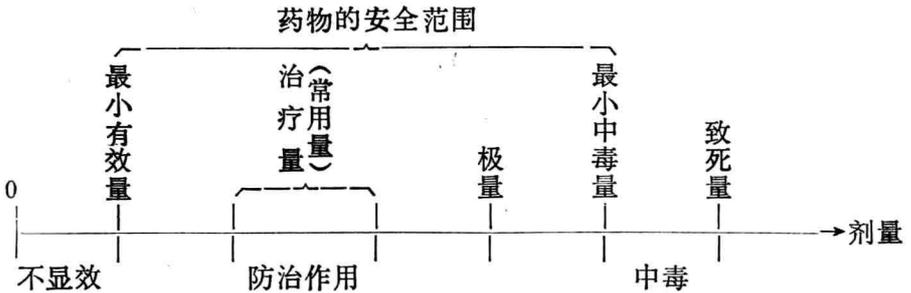


图2-1 药物的各种剂量示意图

2. 生物鉴定 药物的新产品用于人体之前，应检定其效力与毒性，如果不能根据药物的理化性质来检定时，可用生物实验的方法来测定药物的效力和毒性，并和标准品比较以进行检

定，这种方法叫做生物检定，是药物的生产和管理中重要的药理任务之一。在生物鉴定中，表示药物的效力和毒性常用半数有效量（ED<sub>50</sub>）和半数致死量（LD<sub>50</sub>），两者表示在一群动物中引起半数动物发生效应或死亡的剂量。两者的比值（ $\frac{1 \cdot D_{50}}{ED_{50}}$ ）叫治疗指数，是把效力和毒性结合起来评价药物的一种指标，这种来自生物实验的指标，是临床试用新药或新制剂时确保安全而有效的重要参考。但在一般情况下，临床普遍采用更为安全的指标——“药物的安全范围”作为估价药物效力与毒性情况的参考。药物的安全范围是指最小有效量与最小中毒量之间的差距（参看图 2~1），差距越大，安全范围越大，药物越安全，反之，就不安全，容易引起不良反应。

### 3. 儿童用量的计算

(1)按年龄折算法：可根据下表，并参考儿童的发育、营养、体重以及其他情况酌定剂量。

**表2—1 小儿剂量折算表**

年 龄	折合成成人剂量	年 龄	折合成成人剂量
新 生 儿	1/10~1/8	4 岁	1/3
6 个 月	1/8~1/6	8 岁	1/2
1 岁	1/6~1/4	12 岁	2/3

(2)按体重计算法：本法较准确、常用。

先由年龄估计体重：

$$1-6 \text{ 个月婴儿体重 (公斤)} = \text{月龄} \times 0.6 + 3$$

$$7-12 \text{ 个月婴儿体重 (公斤)} = \text{月龄} \times 0.5 + 3$$

$$\text{一周岁以上的儿童体重 (公斤)} = \text{年龄} \times 2 + 8$$

再用估计体重代入下列公式计算剂量：

$$\text{婴幼儿剂量} = \text{估计体重 (公斤)} \times \frac{\text{成人剂量}}{60 (\text{成人平均体重})}$$

### (二)药物作用的相互影响

同时或短期内先后应用两种或多种药物时，这些药物的作用之间可能发生相互影响。它们的作用可以是相似的，可以是相反的。作用相似的药物合用后使作用加强，称为协同作用；作用相反的药物合用后使作用减弱，称为拮抗作用或对抗作用。利用协同作用可以获得较大的防治效果，利用拮抗作用可以防治药物的不良反应。但是，也可因拮抗作用而减弱防治作用，也可因协同作用而加强不良反应，这种情况叫药理性配伍禁忌。此外，两种或是多种药物配伍时，也可能发生化学或物理反应，而使药物潮解、沉淀、变质、失效、甚至产生毒性强的物质，这叫理化性配伍禁忌。在用药实践中应特别注意注射剂的配伍禁忌。

### 三、用药方法方面的因素

(一)给药途径 不同的给药途径不但影响药物作用的强弱和快慢，甚至可能改变作用的性质。例如：口服适量硫酸镁可产生导泻作用，而注射硫酸镁可对中枢神经、骨骼肌、心血管等产生抑制作用。故应根据防治工作的需要选择适当的给药途径。

1. 口服 是最常用的给药途径，优点是简便、经济、安全，凡可口服的情况就应采用口服。缺点是吸收慢而不规则，胃内容物可延缓对药物的吸收。此外、昏迷、抽搐、呕吐者、以及小儿、精神病人等，均不宜口服。在消化道不易吸收或易被消化液破坏的药物也不宜口服。