

医务人员进修丛书

临床药物分册

主审 李光恒 主编 高应斗

山西人民出版社

R19-3
3-4

医务人员进修丛书

临床药物分册

B728.18

主 审 李光恒
主 编 高应斗
编 著 者 崔 琮 吕向华
 平绍烈 张雪吾
特约编辑 王毓銮 张鸿翔

山西人民出版社



280820

临床药物分册

主审 李光恒 主编 高应斗

责任编辑赵玺如

*

山西人民出版社出版 (太原井州北路十一号)

山西省新华书店发行 山西省七二五厂印刷

*

开本: 787×1092 1/16 印张: 20.5 字数: 501千字

1985年12月第1版 1985年12月山西第1次印刷

印数: 1—6,000册

*

书号: 14088·132 定价: 3.45 元

出版说明

现代医学的进展很快，不少理论逐渐在更新，新的知识不断地充实。医药卫生人员迫切希望能有一套内容既系统新颖，形式上又适合自学进修的参考书，以尽快地提高自己的理论技术水平，适应新形势的要求和更好地为“四化”服务。

为了满足这种需要，特别是广大中级医务人员的需要，我们组织了我省医务界有关专家、教授，共同编写了一套《医务人员进修丛书》。

《医务人员进修丛书》是作者们根据其多年教学、临床与科研的经验，并汲取了国内外医学的新成就，分不同学科编写成的。书的内容力求具有科学性、系统性和实用性，力求理论紧密结合实际。同时文字上也力求条理清楚、深入浅出、简明扼要，以便读者自学使用。

本丛书将由基础医学到临床医学，以分册形式，陆续编辑出版。主要对象为中级医务人员，但也适用于其它医药卫生人员和医学院校的学生参考应用。

由于我们的水平所限，书中的缺点与错误在所难免，敬请读者给予批评指正。

山西人民出版社

前 言

本书主要是供临床医师、药师及其他医药工作者自学参考而编写的。为了既精简篇幅又要扼要地反映出国内外药理学的新进展，使读者能迅速地掌握药理学的基础理论和临床的实际应用，对药物和机体的相互作用的共性问题如药效动力学、药代动力学以及影响药物的作用因素，特别是受体学说及环核苷酸学说等统一叙述于总论中，在各章药物中除收载常用药物外又将近年来经临床证实疗效较好而国内已生产的新药，尽量编入书中。本书共分三十章及附录四则，共计收载药品1800余种。在药物的“作用”项内简要阐明其作用及作用机理；在“用途”项内以临床适应症为主；在“注意”项内包括有不良反应、禁忌及其他应注意的问题，以保证安全用药；在“用法”项内所包括的剂量，凡未加注者均系成人用量；老幼用量可参照剂量算法折算之。

为了便于临床应用，又分别按临床各科特点编写了妇产科、五官科、皮肤科等各种用药以及诊断用药和常用解毒药等章节。

本书以西药为主并适量收载有关中草药制剂。书中内容资料及图表有些是自行编写、设计、绘制的，有些是引用有关书籍的，在此向原编著者表示谢意。

由于我们业务水平有限，经验匮乏，书中错误或欠妥之处，在所难免，祈批评指正。

编 者

1984年12月

目 录

第一章 总论	(1)
第一节 概述.....	(1)
第二节 药效动力学——药物对机体的作用.....	(2)
一、药物的基本作用.....	(2)
二、药物作用的主要类型.....	(2)
三、药物作用的机理.....	(3)
第三节 药代动力学——机体对药物的作用.....	(8)
一、细胞膜的药物转运.....	(8)
二、吸收.....	(9)
三、分布.....	(10)
四、代谢(药物转化).....	(10)
五、排泄.....	(11)
六、时效关系及时量关系.....	(12)
七、药代动力学的模型.....	(13)
第四节 影响药物作用的因素.....	(13)
一、药物的因素.....	(13)
二、机体因素.....	(14)
三、药物的用法.....	(15)
第二章 抗生素	(17)
第一节 主要作用于革兰氏阳性菌的抗生素.....	(17)
一、天然青霉素类.....	(17)
二、半合成青霉素类.....	(19)
三、先锋霉素类(头孢菌素类).....	(21)
四、大环内酯类和其他.....	(21)
第二节 主要作用于革兰氏阴性菌的抗生素.....	(23)
一、氨基武类.....	(23)
二、多粘菌素类.....	(25)
三、创新霉素.....	(25)
第三节 广谱抗生素.....	(25)
一、四环素类.....	(26)
二、氯霉素类.....	(27)
第三章 抗真菌药和抗病毒药	(29)
第一节 抗真菌药.....	(29)

一、抗真菌抗生素.....	(29)
二、合成抗真菌药.....	(30)
第二节 抗病毒药.....	(31)
一、合成抗病毒药.....	(31)
二、干扰素诱导剂.....	(32)
第四章 磺胺类及其他抗菌药	(34)
第一节 磺胺类药物.....	(34)
第二节 其他合成抗菌药.....	(38)
第三节 抗菌中草药提取物.....	(40)
第五章 抗结核及抗麻风药	(42)
第一节 抗结核病药.....	(42)
第二节 抗麻风病药.....	(46)
第六章 抗寄生虫病药	(48)
第一节 驱肠虫药.....	(48)
一、主要用于驱蛔虫的药物.....	(48)
二、驱钩虫药.....	(49)
三、主要用于驱蛲虫的药物.....	(50)
四、驱绦虫药.....	(50)
第二节 抗疟药.....	(51)
一、控制症状药.....	(51)
二、控制复发药.....	(52)
三、疟疾预防药.....	(53)
四、其他抗疟药的联合应用.....	(53)
第三节 抗阿米巴病药.....	(53)
一、主要用于肠内阿米巴病药.....	(53)
二、主要用于肠外阿米巴病的药物.....	(54)
第七章 抗肿瘤药	(56)
第一节 抗肿瘤药的作用.....	(56)
第二节 抗肿瘤药的应用.....	(58)
第三节 常用抗肿瘤药物.....	(60)
一、烷化剂.....	(60)
二、抗代谢药.....	(62)
三、抗肿瘤抗生素.....	(63)
四、植物药.....	(64)
五、杂类.....	(65)
六、激素类.....	(66)
第八章 麻醉用药	(67)
第一节 全身麻醉药.....	(67)
一、吸入麻醉药.....	(67)
二、静脉麻醉药.....	(68)

第二节 局部麻醉药	(69)
第三节 麻醉辅助药	(71)
第九章 镇静、催眠药	(72)
一、巴比妥类	(72)
二、醛类	(73)
三、溴化物	(74)
四、其它	(74)
第十章 抗癫痫、抗惊厥药	(75)
第一节 抗癫痫药	(75)
一、常用于大发作和局限性发作的药物	(75)
二、常用于小发作的药物	(76)
三、常用于精神运动性发作的药物	(76)
第二节 抗惊厥药	(76)
第十一章 精神神经病用药	(78)
第一节 抗精神病药	(78)
第二节 抗焦虑症药	(81)
第三节 抗忧郁症药(精神兴奋药)	(83)
第十二章 镇痛、解热镇痛、消炎镇痛及抗痛风药	(86)
第一节 镇痛药	(86)
第二节 解热镇痛药	(88)
第三节 消炎镇痛药(抗风湿药)	(90)
第四节 抗痛风药	(92)
第十三章 中枢兴奋药	(93)
第一节 主要兴奋大脑皮层的药物	(93)
第二节 主要兴奋呼吸中枢的药物	(95)
第十四章 传出神经系统的药物	(97)
第一节 概述	(97)
一、传出神经分类与化学传递	(97)
二、传出神经递质的作用与受体	(97)
三、传出神经递质的代谢	(100)
四、传出神经药的作用与分类	(101)
第二节 拟胆碱药	(102)
一、直接作用于胆碱受体的药物	(102)
二、抗胆碱酯酶药(胆碱酯酶抑制药)	(103)
第三节 抗胆碱药	(104)
一、平滑肌解痉药(M受体阻断药)	(104)
二、中枢性抗胆碱药(抗震颤麻痹药)	(106)
三、神经节阻断药(N_1 受体阻断药)	(107)
四、骨骼肌松弛药(N_2 受体阻断药)	(107)
第四节 拟肾上腺素药	(108)

一、 α 、 β 受体兴奋药	(108)
二、 α 受体兴奋药	(109)
三、 β 受体兴奋药	(110)
第五节 抗肾上腺素药	(113)
一、 α 受体阻断药	(113)
二、 β 受体阻断药	(113)
第十五章 组织胺与抗组织胺药	(114)
第一节 组织胺类	(114)
第二节 抗组织胺药	(114)
一、 H_1 受体拮抗药	(115)
二、过敏递质阻释药	(116)
三、 H_2 受体阻断药	(116)
第十六章 作用于心血管系统的药物	(118)
第一节 强心甙	(118)
一、心力衰竭概述	(118)
二、强心甙的作用	(118)
三、强心甙的用途	(119)
四、强心甙的用法	(120)
五、强心甙的不良反应及其防治	(120)
六、强心甙应用的注意事项	(122)
七、强心甙类常用药物	(122)
第二节 抗心律失常药	(123)
一、心律失常概述	(123)
二、心肌电生理	(124)
三、抗心律失常药的作用	(125)
四、抗心律失常药的用途	(125)
五、抗心律失常药的注意事项	(125)
六、常用抗心律失常药	(126)
第三节 抗心绞痛药	(130)
一、硝酸酯及亚硝酸酯类	(130)
二、非硝酸酯冠状动脉扩张药(扩冠药)	(131)
三、钙离子拮抗剂(钙转运阻滞药)	(133)
四、 β 受体阻断药	(134)
五、中草药制剂	(134)
第四节 降血脂、防治动脉粥样硬化药	(134)
一、降血脂药	(135)
二、防治动脉粥样硬化药	(136)
第五节 抗高血压药	(136)
第六节 周围血管扩张药	(141)
一、作用于肾上腺素受体的药物	(141)

二、直接作用于血管平滑肌的药物	(142)
第七节 抗休克药	(143)
一、血管收缩药(升压药)	(144)
二、血管扩张药	(144)
第十七章 影响血液与造血系统的药物	(146)
第一节 凝血药与抗凝血药	(146)
一、凝血药	(146)
二、抗凝血药	(149)
第二节 抗贫血药	(151)
一、铁制剂	(152)
二、叶酸类	(153)
三、维生素 B ₁₂ 类	(153)
第三节 白细胞增生药	(154)
第十八章 血浆及其代用品	(156)
第十九章 调节水、电解质、酸碱平衡的药物	(159)
第一节 调节水、电解质的药物	(159)
第二节 调节酸碱平衡的药物	(161)
第二十章 消化系统疾患用药	(164)
第一节 健胃消化药	(164)
第二节 抗酸及消化性溃疡药	(165)
第三节 胃肠解痉药	(169)
第四节 催吐及止吐药	(170)
第五节 泻药, 止泻药	(172)
一、泻药	(172)
二、止泻药	(173)
第六节 肝胆疾患辅助治疗药	(173)
一、抗脂肪肝药	(173)
二、解毒药	(173)
三、促进代谢药	(174)
四、降血氨药	(174)
五、中药制剂	(175)
第七节 利胆药	(176)
第二十一章 祛痰、镇咳、平喘及治疗矽肺药	(178)
第一节 祛痰药	(178)
第二节 镇咳药	(179)
第三节 平喘药	(181)
第四节 酶制剂	(185)
第五节 治疗矽肺药	(185)
第二十二章 利尿药和抗利尿药	(187)
第一节 利尿药	(187)

第二节 脱水药	(191)
第三节 抗利尿药	(192)
附：治遗尿药	(193)
第二十三章 激素类药物	(194)
第一节 肾上腺皮质激素类及促肾上腺皮质激素	(194)
一、盐皮质激素	(194)
二、糖皮质激素	(194)
三、促肾上腺皮质激素	(197)
第二节 性激素	(198)
一、雌激素	(198)
二、孕激素	(198)
三、雄激素与同化激素	(199)
四、促性腺激素	(200)
第三节 甲状腺激素与抗甲状腺药	(200)
一、甲状腺激素	(200)
二、抗甲状腺药	(200)
第四节 抗糖尿病药（附：升血糖药与木糖醇）	(202)
一、胰岛素制剂	(203)
二、口服降血糖药	(204)
第二十四章 影响免疫功能的药物	(206)
第一节 免疫增强剂	(206)
一、主要提高巨噬细胞吞噬功能的药物	(206)
二、主要提高细胞免疫的药物	(207)
三、影响体液免疫的药物	(208)
四、干扰素及其诱导剂	(209)
第二节 免疫抑制剂	(209)
第二十五章 维生素类	(211)
第一节 水溶性维生素	(211)
第二节 脂溶性维生素	(213)
第二十六章 妇产科用药	(215)
第一节 子宫收缩药	(215)
第二节 调经药	(216)
第三节 避孕药	(220)
一、女用短效口服避孕药	(220)
二、女用长效口服避孕药	(220)
三、长效注射避孕药	(221)
四、探亲避孕药	(221)
五、外用避孕药	(221)
六、中期引产药	(222)
七、男用避孕药	(223)

第四节 治疗子宫外孕的药物·····	(224)
第二十七章 消毒防腐药与五官、皮肤科用药·····	(227)
第一节 消毒防腐药·····	(227)
一、酚、醇、醛、酸类·····	(227)
二、卤素类·····	(228)
三、氧化剂类·····	(229)
四、表面活性剂类·····	(229)
五、染料类·····	(230)
六、重金属盐类·····	(230)
七、其他·····	(231)
第二节 口腔科用药·····	(231)
一、用于拔牙的局麻制剂·····	(231)
二、用于防龋脱敏的制剂·····	(232)
三、用于消毒、消炎的制剂·····	(232)
四、用于牙髓的制剂·····	(232)
五、用于牙痛的制剂·····	(233)
第三节 眼科用药·····	(233)
一、散瞳、验光药·····	(233)
二、青光眼治疗药·····	(233)
三、白内障治疗药·····	(234)
四、治疗沙眼、结膜炎、角膜炎、巩膜炎、虹膜炎、睑缘炎、角膜溃疡、 疱疹性眼病等及眼科手术后用药·····	(235)
五、具有收敛、防腐、杀菌、腐蚀性的药物·····	(236)
六、用于视网膜震荡、球后视神经炎、视神经萎缩、视网膜色素变性等症 的药物·····	(236)
七、眼用表面麻醉药·····	(236)
八、用于角膜实质炎、角膜斑翳、虹膜睫状体炎、巩膜炎、各种角膜炎后期 的角膜混浊、陈旧性玻璃体出血混浊等的药物·····	(236)
九、用于眼部过敏疾患、化学药品伤害的药物·····	(236)
十、其他眼用药物·····	(237)
第四节 耳鼻喉科用药·····	(237)
一、耳部常用药·····	(237)
二、鼻部常用药·····	(238)
三、喉部用药·····	(238)
第五节 皮肤科用药·····	(239)
一、溶液剂·····	(239)
二、酊剂、醑剂及其他醇制溶液·····	(239)
三、洗剂·····	(240)
四、粉剂·····	(240)
五、油糊剂、软膏、乳膏·····	(241)

六、气雾剂·····	(241)
七、硬膏剂·····	(242)
第二十八章 诊断用药 ·····	(243)
第一节 器官功能检查用药·····	(243)
一、用于测定血循环时间的药物·····	(243)
二、用于测定血容量的药物·····	(243)
三、用于测定胃分泌的药物·····	(243)
四、用于测定肾功能的药物·····	(244)
五、用于测定肝功能的药物·····	(244)
六、用于测定妊娠的药物·····	(244)
第二节 X线诊断用药·····	(244)
一、胃肠造影剂·····	(245)
二、胆囊造影剂·····	(245)
三、尿路、血管造影剂·····	(246)
四、支气管、子宫、输卵管造影剂(油脂类造影剂)·····	(247)
第三节 放射性药物·····	(247)
一、放射性药物的用途·····	(247)
二、放射性药物使用通则·····	(248)
三、放射性药物的毒性·····	(248)
四、常用放射性药物·····	(248)
第二十九章 常用解毒药 ·····	(250)
一、急性中毒的处理原则·····	(250)
二、一般解毒药·····	(250)
三、特异性解毒药·····	(251)
第三十章 驱避剂及其他 ·····	(256)
第一节 驱避剂·····	(256)
第二节 其他·····	(256)
附录一 药物相互作用·····	(257)
附录二 药源性疾病·····	(265)
附录三 剂量计算法·····	(271)
附录四 从身高体重折算体表面积(平方米)表·····	(273)
中文索引·····	(274)
外文索引·····	(297)

第一章 总 论

第一节 概 述

凡是能治疗、预防和诊断疾病或用于计划生育、杀灭病媒及消毒污物的物质统称为药物。医务工作者，必须对药物的性能、作用机理、临床应用（包括不良反应、禁忌症等）等有深刻的了解。病人也应该具备药物知识才能与医生配合好，使药物在防治疾病中发挥最理想的效果。早在公元一世纪我国就有《神农本草经》这部药物学，历代又有多部类似的著作。明代杰出的医学家及药学家李时珍以毕生的精力，编写成收载药物1982种的药物学巨著《本草纲目》，内容丰富，对人类作出了杰出的贡献，受到各国学者的重视和赞扬。

西医药学也和我国的医药学的发展一样，在17~18世纪以后特别是从19世纪以来，随着现代工业和现代自然科学的迅速发展，特别是生理学、生化学、有机化学的发展，为发明创造新的药物作出了贡献。由植物药利用理化方法的提取到人工药物的合成，再经过实验生理生化学的方法观察了药物对生理生化功能的影响，从而对药理学的发展提供了可靠的科学实验方法。另一方面也利用某些化学药物分析阐明了许多生理生化的功能，起到了互相促进的作用。近几十年来新技术的不断涌现，医药工作者也利用新的科学实验方法研究药物，生产药物，对药物作用的认识有了飞跃的发展。在深度方面由整体观察到器官效应，又进入到细胞、亚细胞水平。近年来更向着分子药理学、量子药理学发展，逐渐从药物分子和机体分子关系的基础上进一步阐明了药物的作用。自从70年代分离提纯出受体（受点）后，受体的假说得到证实，它是一个可辨识的实体。受体学说除被认为是特异性结构药物产生效应的科学解释外，还被应用于生物学的许多学科，阐明了多种生物活性物质和激素的作用原理以及某些疾病的发病原理。在某些药物的作用方面，也用受体的学说阐明了其作用机理。另外从环核苷酸中分离出正常细胞内代谢保持一定比例调节的环磷酸腺苷（cAMP）和环磷酸鸟苷（cGMP）；两者能互相影响，是一对拮抗物质，对生物细胞具有相反的双向调节作用。机体内许多生理过程的兴奋或抑制，也取决于细胞内cAMP/cGMP值的变化。某些药物可以改变其在体内的浓度，因此也可用其研究某些药物的作用机理。此外，近年来又发现机体内另一对相互制约、相互拮抗的细胞功能调节因子，即血小板凝集素 A_2 （ TXA_2 ）和前列腺素（ PGI_2 ）。前者为血小板聚集的强诱导剂，并有收缩血管作用；后者为血小板聚集的强抑制剂，并有扩张血管作用。二者可调节和控制血栓的形成过程。凡能对抗 TXA_2 或增强 PGI_2 的药物，必将有利于血栓栓塞性疾病的防治等，也可用以研究某些药物的作用机理。在广度方面，目前已出现了许多边缘学科的分支，如生化药理学，精神药理学、免疫药理学、遗传药理学、临床药理学和环境药理学等，分科愈细，专业性也愈强。

解放以来我国的药物和药理学同其他科学一样，也在逐步取得进展，从事药学和药理的科技人员数量增加，水平也不断提高，运用先进科学技术对中草药的整理提纯，或是新药的

合成，都是日新月异，品种不断增加，科学理论水平（包括药物作用的机理）也日益深入提高。医药工作者今后将继续努力，为控制和消灭严重危害人民的多种疾病，保障人民的健康，不断地取得新成果，做出更大的贡献。

第二节 药效动力学——药物对机体的作用

一、药物的基本作用

药物对机体的作用是在药物的影响下机体发生的机能或形态的变化。凡能加强机体的原有生理机能活动的叫做兴奋，减弱者叫做抑制。过度的兴奋可引起痉挛或惊厥，过度的抑制可引起麻痹。有些药物能直接或间接地消灭已侵入或未侵入机体内的病原微生物或寄生虫以及病原媒介等，以防治疾病。有的药物可以补偿机体某些正常代谢所缺乏的物质。以上这些都是药物最基本的作用。

二、药物作用的主要类型

（一）按作用的范围可分为局部作用和吸收作用 所谓局部作用就是药物在吸收入血以前，对其所接触的组织的直接作用。所谓吸收作用，就是当药物被机体吸收后，随着体液分布到各个器官或组织而呈现的作用，有时也称为全身作用。药物的局部作用也可通过神经反射和体液联系等过程引起全身性反应，这些反应叫做间接作用或继发作用。

（二）按药物对各部位作用的强度可分为选择作用及普遍细胞作用 所谓选择作用是药物进入机体后，对某些器官或组织呈现较为突出的作用。这是因为各种组织和细胞的生化过程各有其特点，有的组织细胞对药物的反应性高，或药物与其亲和力大所致。但选择作用随着剂量的改变，也能影响多种组织的生化过程，故有多种选择作用。所谓普遍细胞作用是药物对各种器官或组织都有类似的作用，此类药物大都有损伤组织的毒性，故亦称为原生质毒。

（三）按用药的目的可分为防治作用和不良反应

1. 防治作用 防治作用又分为预防作用和治疗作用，预防作用就是用药后能预先防止疾病发生的作用。治疗作用就是药物针对治疗疾病的需要所发生的作用。又可分为对因治疗及对症治疗。对因治疗为消除致病原因的方法，此法亦称为特效治疗，所用的药物为特效药，它能消除病因而达到根治的效应。对症治疗为消除疾病症状的方法。有利于缓解症状，改善休息和饮食，增强抵抗力，防止病情的恶化等。

2. 不良反应 药物既能防治疾病，也可产生不良反应。所谓不良反应就是药物发生的对防治疾病无益而有害的反应，可分四种类型：

（1）副作用 药物在治疗剂量下发生防治作用的同时，出现一些与治疗目的无关的作用。病人可感到轻微的不适。有时适当合并用药可减轻或避免副作用。

（2）毒性作用 用药量过大、时间过长或个体对某种药物敏感性较高时出现对人体危害的反应。有时也可由医疗差错或意外事故而发生。立即发生的毒性作用称为急性毒性，长期蓄积后逐渐发生的称为慢性毒性，严重的毒性反应为肝、肾、中枢神经、造血系统或心血管系统等的反应，如肝功减退、黄疸、血尿、惊厥、昏迷、粒细胞缺乏症、再生障碍性贫血、心律失常等。

（3）过敏反应 参见本章第四节机体因素的个体差异项下。

（4）后遗效应 停药后体内药物浓度虽已降到阈浓度以下，但可残存难恢复的效应或

不可逆性的器质损害。对于后者，用药时应注意之。

三、药物作用的机理

药物作用的机理就是药物发生作用的道理。随着科学技术的发展，对药物作用机理的研究也不断深入。由宏观到微观，由细胞到分子水平，逐步阐明药物的作用道理是永无止境的。药物是通过参与或干扰复杂机体的生理生化过程而发挥作用的，但药物的性质各不相同，所以作用机理也是多种多样的。现简要介绍如下：

(一) 理化性质的改变 主要是通过改变细胞或组织周围的理化性质。例如抗酸药是通过中和作用而降低胃酸的酸度。

(二) 参与或干扰机体的合成或代谢过程 应用药物后能供给机体参与正常生理代谢过程中所缺乏的物质，以补充体内的不足，例如激素及维生素、无机盐等。有些药物的化学结构和性质相似于正常代谢物，或类似生化过程的某种原料或中间体，在体内以假乱真，干扰病原体的生化过程，例如磺胺类药物的抑菌作用等。

(三) 改变酶的活性 有些药物可以通过对酶的促进或抑制而发挥作用，例如胰岛素能促进己糖激酶活性，新斯的明能抑制胆碱酯酶而发挥作用。

(四) 对生物膜的作用 生物膜是各组织或器官之间，细胞之间及细胞器之间的屏障结构，有的药物能影响这些膜的功能而发挥作用。例如苯妥英钠能稳定细胞膜影响离子转运而抗癫痫；利尿药通过抑制肾小管对钠离子或氯离子的再吸收作用而达到排盐利尿作用。

(五) 对活性物质释放的影响 有些药物的作用是通过改变维持生理功能或病理反应的神递质、激素和淋巴因子等的释放而产生效应的。例如麻黄碱可促进肾上腺素能神经末梢释放递质去甲肾上腺素，溴苄胺则可抑制其释放，所以二者具有拟肾上腺素及抗肾上腺素的作用。

(六) 对受体的影响 在细胞表面或细胞内能与某些药物直接发生特异性结合，导致组织或器官发生特殊效应的化学基团，称为受体，亦称受点。它是蛋白质、酶或酶系统的一部分，有的受体已被分离提纯，并证实了其表面构型。药物与受体的结合有的能兴奋受体，有的能阻断受体，其作用强度和药物与受体的亲和力有关。亲和力就是药物与受体的结合力。而药物作用的性质与药物的内在活性（或效应力）有关，内在活性就是药物与受体结合形成复合物时，药物发生效应的能力。受体兴奋就可使效应器官功能兴奋或是抑制，例如肾上腺素 β 受体的兴奋表现为心肌收缩力加强心率加快，传导加快、支气管舒张等。作用于受体的药物有兴奋剂和抑制剂之别。为什么能对受体产生兴奋或抑制？凡是药物与相应受体既有大的亲和力又有明显的内在活性，此药物就能引起该受体的兴奋效应，称为该受体的兴奋剂或激动剂。若药物与相应受体的亲和力虽大，但无内在活性，就可竞争性地起到阻断兴奋剂的作用，使该受体产生抑制效应，称为该受体的阻断剂或拮抗剂。例如异丙肾上腺素是 β 受体的兴奋剂，心得安是 β 受体的抑制剂。

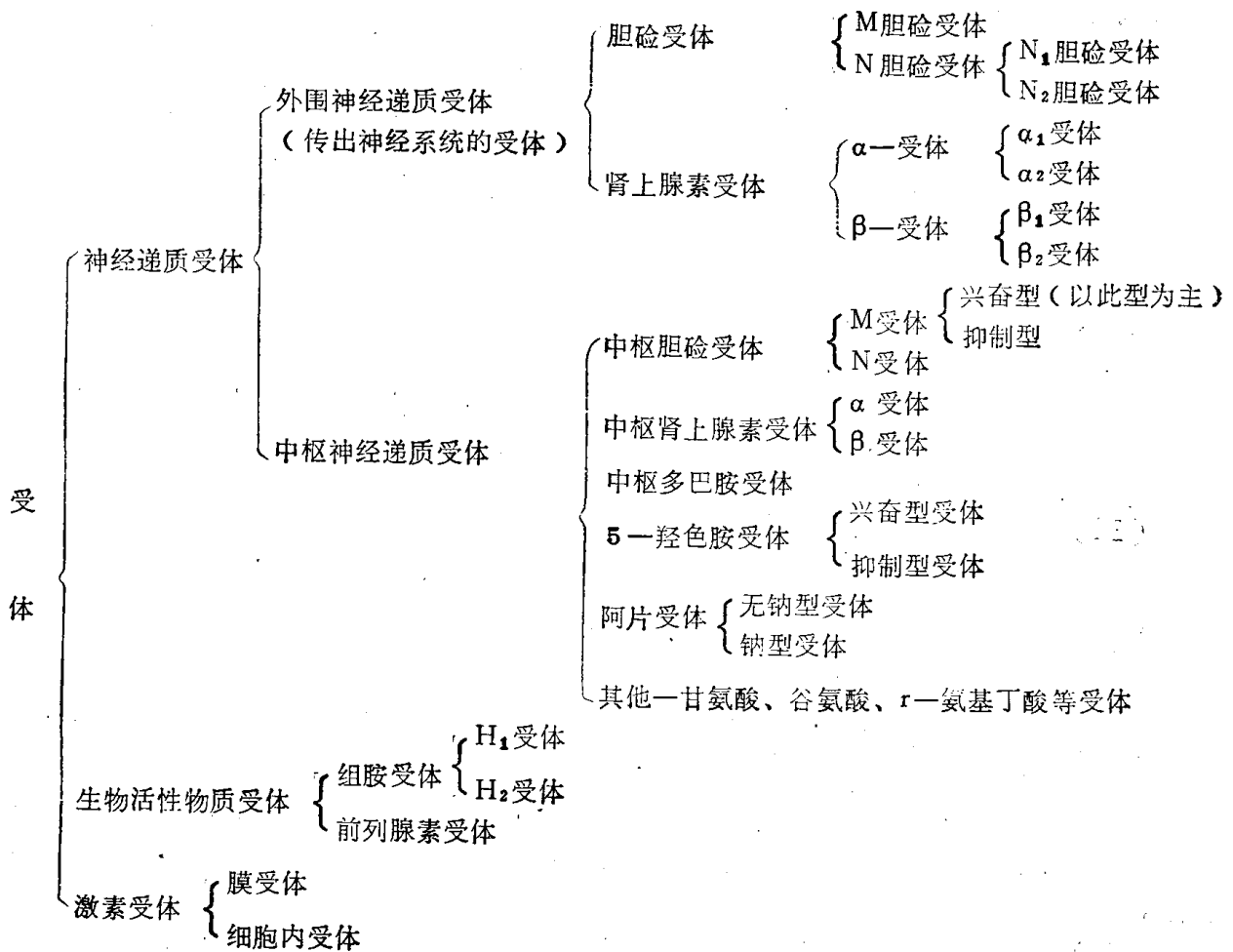
各种受体的名称是按与之结合的递质、激素、生物活性物质或药物来命名的。如能与乙酰胆碱结合的受体称为胆碱受体，与组织胺结合的受体称为组织胺受体，与吗啡结合的称为吗啡受体等，余类推。各种受体都有其固定的分布及功能。为了便于理解，将已知受体分类列表于后见（表1—1）。

1. 药物和受体相互作用与效应关系的学说

(1) 占领学说 最初认为药物作用强度与药物占领受体数量成正比。后又被修正为药物—受体相互作用而引起效应时，不仅需要两者的亲和力相结合，而且需要内在活性激活受

表1-1

受体分类表



体产生效应。如激动药内在活性强，拮抗药无内在活性，部分激动药则在两者之间，故可产生不同的效应。

(2) 速率学说：认为药物的兴奋作用与单位时间内药物与其受体接触的总次数成正比。即药物的效应仅是药物分子与受体间的结合速率与离解速率的函数。激动药离解速率大，部分激动药次之，而拮抗药离解速率低，故可产生不同的效应。

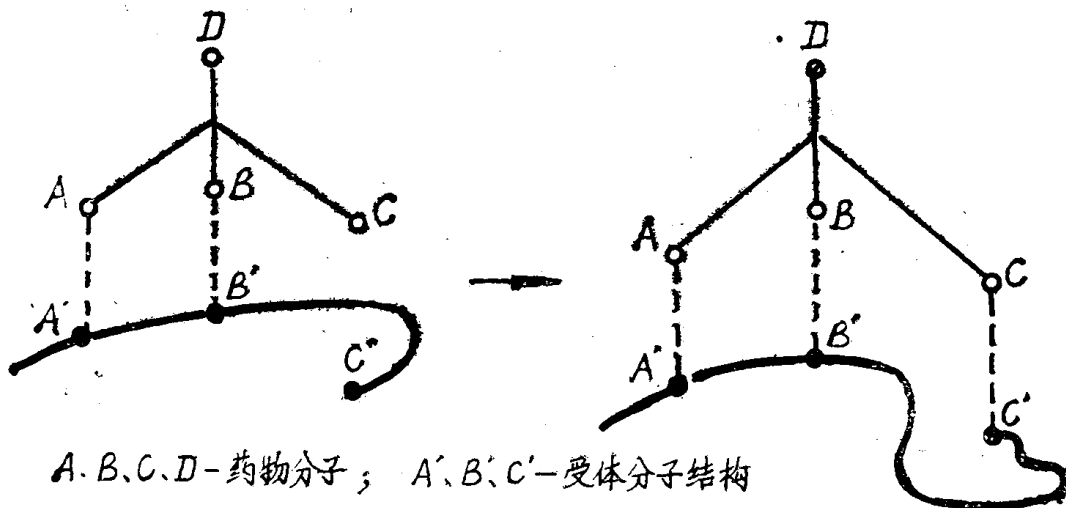


图1-1 药物与受体大分子结合的可能形式